

**JP2001247411A**

**2001-9-11**

**Bibliographic Fields**

**Document Identity**

(19)【発行国】

日本国特許庁(JP)

(12)【公報種別】

公開特許公報(A)

(11)【公開番号】

特開2001-247411(P2001-247411  
A)

(43)【公開日】

平成13年9月11日(2001. 9. 11)

(19) [Publication Office]

Japan Patent Office (JP)

(12) [Kind of Document]

Unexamined Patent Publication (A)

(11) [Publication Number of Unexamined Application]

Japan Unexamined Patent Publication 2001- 247411 (P2001-  
247411A)

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

Heisei 13\*September 11\* (2001.9.11)

**Public Availability**

(43)【公開日】

平成13年9月11日(2001. 9. 11)

(43) [Publication Date of Unexamined Application]

Heisei 13\*September 11\* (2001.9.11)

**Technical**

(54)【発明の名称】

有害生物防除剤

(51)【国際特許分類第7版】

A01N 43/54

C07D239/38

239/42

【FI】

A01N 43/54 B

C

D

C07D239/38

239/42 Z

【請求項の数】

3

【出願形態】

OL

【全頁数】

27

【テーマコード(参考)】

4H011

(54) [Title of Invention]

**PEST CONTROL AGENT**

(51) [International Patent Classification, 7th Edition]

A01N 43/54

C07D239/38

239/42

[FI]

A01N 43/54 B

C

D

C07D239/38

239/42 Z

[Number of Claims]

3

[Form of Application]

OL

[Number of Pages in Document]

27

[Theme Code (For Reference)]

4H011

**JP2001247411A**

**2001-9-11**

**【F ターム(参考)】**

4H011 AA01 AA03 AC01 BA01 BB09 BC03  
BC07 DA15 DD03 DE15

**[F Term (For Reference)]**

4H011 AA01 AA03 AC01 BA 01 BB09 BC 03 BC 07 DA15  
DD03 DE15

**Filing**

**【審査請求】**

未請求

**[Request for Examination]**

Unrequested

**(21)【出願番号】**

特願2000-65215(P2000-65215)

**(21) [Application Number]**

Japan Patent Application 2000- 65215 (P2000- 65215)

**(22)【出願日】**

平成12年3月9日(2000. 3. 9)

**(22) [Application Date]**

2000 March 9\* (2000.3.9)

**Parties**

**Applicants**

**(71)【出願人】**

**【識別番号】**

391003255

**(71) [Applicant]**

**[Identification Number]**

391003255

**【氏名又は名称】**

株式会社トモノアグリカ

**[Name]**

**TOMONO AGRICA CO., LTD.**

**【住所又は居所】**

静岡県静岡市春日2丁目12番25号

**[Address]**

Shizuoka Prefecture Shizuoka City Kasuga 2-Chome 12\*25\*

**Inventors**

**(72)【発明者】**

**【氏名】**

久保山 信弘

**(72) [Inventor]**

**[Name]**

Kuboyama Nobuhiro

**【住所又は居所】**

静岡県島田市大柳290 株式会社トモノアグリ  
カ内

**[Address]**

Shizuoka Prefecture Shimada City \*\*290 Tomono Agrica  
Co., Ltd. \*

**(72)【発明者】**

**【氏名】**

伴野 広太郎

**(72) [Inventor]**

**[Name]**

Tomono \*Taro

**【住所又は居所】**

静岡県静岡市春日2-12-25 株式会社ト  
モノアグリカ内

**[Address]**

Shizuoka Prefecture Shizuoka City Kasuga 2- 12- 25 Tomono  
Agrica Co., Ltd. \*

**Agents**

**(74)【代理人】**

**【識別番号】**

100065215

**(74) [Attorney(s) Representing All Applicants]**

**[Identification Number]**

100065215

JP2001247411A

2001-9-11

【弁理士】

[Patent Attorney]

【氏名又は名称】

[Name]

三枝 英二 (外8名)

Saegusa \*\* (\*8 persons )

Abstract

(57)【要約】

(57) [Abstract]

【課題】

[Problems to be Solved by the Invention]

優れた有害生物防除剤を提供する。

pest control agent which is superior is offered.

【解決手段】

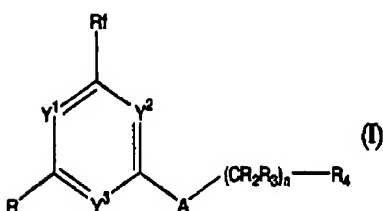
[Means to Solve the Problems]

一般式(I)

General Formula (I )

【化 1】

[Chemical Formula 1]



【式中、Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup>, Y<sup>3</sup>, R, R<sup>f</sup>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, A および n は、明細書に定義した通りである。】で表される化合物またはその塩を有効成分とする有害生物防除剤。

pest control agent . which designates compound or its salt which is displayed with {In Formula, Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup>, Y<sup>3</sup>, R, R<sup>f</sup>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, A and n are, as defined in Specification . } as active ingredient

Claims

【特許請求の範囲】

[Claim(s)]

【請求項 1】

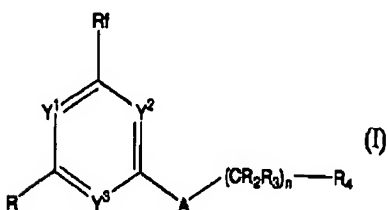
[Claim 1]

一般式(I)

General Formula (I )

【化 1】

[Chemical Formula 1]



【式中、Y<sup>1</sup> は N または CR<sup>1a</sup> を示し、Y<sup>2</sup> は N または CR<sup>2a</sup> を示し、Y<sup>3</sup> は N または CR<sup>3a</sup> を示す(R<sup>1a</sup>, R<sup>2a</sup> 及び R<sup>3a</sup> は、各々水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、置換基を有してもよい C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基、ハロゲン原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基、シアノ基、水酸基、アミノ基、置換基を有してもよいモノアルキルアミノ基または置換基を有してもよいジアル

{In Formula, Y<sup>1</sup> shows N or CR<sup>1a</sup>, Y<sup>2</sup> shows N or CR<sup>2a</sup>, Y<sup>3</sup> shows N or CR<sup>3a</sup>, (R<sup>1a</sup>, R<sup>2a</sup> and R<sup>3a</sup> show dialkyl amino group which is possible to possess monoalkyl amino group or substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group , cyano group , hydroxy group , amino group , substituent

キルアミノ基を示す;但し、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 及び $Y^3$ の2つがNを示す)。R、Rfは、それぞれ独立に、水素原子、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、置換基を有してもよい $C_7\sim C_{10}$ アラルキル基、ハロゲン原子、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、シアノ基、水酸基、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル基、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、置換基を有してもよいモノアルキルアミノ基、置換基を有してもよいジアルキルアミノ基、置換基を有してもよいアシルアミノ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニルアミノ基を示す(但し、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 及び $R^{3a}$ 、のいずれか1種及びR及びRfの少なくとも1つは $C_1\sim C_6$ ハロアルキル基を示す)。Aは、 $NR_1$ 、O、S、SOまたは $SO_2$ を表す( $R_1$ は水素原子、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、置換基を有してもよい $C_2\sim C_6$ アルケニル基、置換基を有してもよい $C_2\sim C_6$ アルキニル基、置換基を有してもよい $C_7\sim C_{10}$ アラルキル基、置換基を有してもよいアシル基、置換基を有してもよいカルバモイル基または置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基を示す)。 $R_2$ 及び $R_3$ は、それぞれ独立に水素原子、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキル基、置換基を有してもよい $C_7\sim C_{10}$ アラルキル基を示す。 $R_4$ は、水素原子、置換基を有してもよい $C_1\sim C_{18}$ アルキル基、置換基を有してもよい $C_3\sim C_8$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいナフチル基、置換基を有してもよい $C_7\sim C_{10}$ アラルキル基、置換基を有してもよい複素環基、置換基を有してもよいフェノキシ基(ただし、 $-A-(CR_2R_3)_n-R_4$ が $-SO_2CH_2CH_2Ophenyl$ である時を除く)、置換基を有してもよいフェニルチオ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基、置換基を有してもよいフェノキシカルボニル基、置換基を有してもよいアラルキルオキシカルボニル基を示し、nは0~5を示す。(但し、 $Y^1=N$ 、 $Y^2=N$ 、 $R^{3a}=H$ 、 $n=1$ で、 $Rf=C_1\sim C_6$ アルキル基または水素原子、 $R=CF_3$ 、 $A=NH$ を表すとき、 $R_2=R_3=H$ を示す。また、 $n=1$ で、R、Rfがアミノ基、モノアルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、アルコキシ基またはアルキルチオ基を示すとき、AはNHではない。)]

which is possible to possess

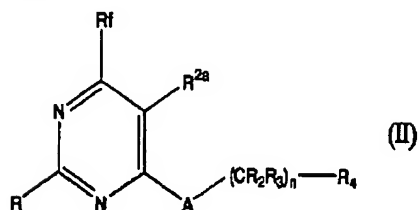
$C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, halogen atom, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is possible to possess each hydrogen atom, substituent,; however, two of the  $Y_{<sup>1</sup>}$ ,  $Y_{<sup>2</sup>}$  and  $Y_{<sup>3</sup>}$  shows N. ). As for R, Rf, in respective independence, carbamoyl amino group which is possible to possess alkoxy carbonyl amino group, substituent which is possible to possess acyl amino group, substituent which is possible to possess dialkyl amino group, substituent which is possible to possess monoalkyl amino group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl sulfonyl group, amino group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl sulfanyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl thio group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkoxy group, cyano group, hydroxy group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, halogen atom, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent is shown, (However, at least one of any 1 kind and R and Rf of the  $R_{<sup>1a</sup>}$ ,  $R_{<sup>2a</sup>}$  and  $R_{<sup>3a</sup>}$ , shows  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ haloalkyl group. ). A displays  $NR_{<sub>1</sub>}$ , O, S, SO or  $SO_{<sub>2</sub>}$ , ( $R_{<sub>1</sub>}$  shows alkoxy carbonyl group which is possible to possess carbamoyl group or substituent which is possible to possess acyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkynyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkenyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent. ).  $R_{<sub>2</sub>}$  and  $R_{<sub>3</sub>}$  show  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is possible to possess independence to possess hydrogen atom, substituent. As for  $R_{<sub>4</sub>}$ , phenoxy group which is possible to possess heterocyclic group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, substituent which is possible to possess naphthyl group, substituent which is possible to possess phenyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>3</sub>}\sim C_{<sub>8</sub>}$ cycloalkyl group, substituent which is possible to possess

で表される化合物またはその塩を有効成分とする有害生物防除剤。

【請求項 2】

一般式(II)

【化 2】



〔式中、R<sup>2a</sup>は、水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、置換基を有してもよい C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基、ハロゲン原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基、シアノ基、水酸基、アミノ基、置換基を有してもよいモノアルキルアミノ基または置換基を有してもよいジアルキルアミノ基を示す。R、Rf は、それぞれ独立に、水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、置換基を有してもよい C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基、ハロゲン原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基、シアノ基、水酸基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルチオ基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル基、アミノ基、置換基を有してもよいモノアルキルアミノ基、置換基を有してもよいジアルキルアミノ基、置換基を有してもよいアシルアミノ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニルアミノ基、置換基を有してもよいカルバモイルアミノ基を示す。(但し、R、Rf 及び R<sup>2a</sup> のうち、少なくと

C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent (However, when -A- (CR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>)<sub>n</sub>-SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ophenyl being you exclude), aralkyloxy carbonyl group which is possible to possess phenoxy carbonyl group, substituent which is possible to possess alkoxy carbonyl group, substituent which is possible to possess phenylthio group, substituent which is possible to possess substituent showing, n shows 0 - 5. (However, when with Y<sup>1</sup>=N, Y<sup>2</sup>=N, R<sup>3a</sup>=H, n=1, displaying Rf =C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group or hydrogen atom, R=CF<sub>3</sub>, A=NH, the R<sub>2</sub>=R<sub>3</sub>=H is shown. In addition, when with n=1, R, Rf shows amino group, monoalkyl amino group, dialkyl amino group, alkoxy group or alkylthio group, A is not NH. ) }

So pest control agent . which designates compound or its salt which is displayed as the active ingredient

[Claim 2]

General Formula (II )

[Chemical Formula 2]

{In Formula, R<sup>2a</sup> shows dialkyl amino group which is possible to possess monoalkyl amino group or substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group, cyano group, hydroxy group, amino group, substituent which is possible to possess C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group, halogen atom, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent . As for R, Rf, in respective independence, carbamoyl amino group which is possible to possess alkoxy carbonyl amino group, substituent which is possible to possess acyl amino group, substituent which is possible to possess dialkyl amino group, substituent which is possible to possess monoalkyl amino group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl group, amino group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfinyl group, substituent which is possible to possess

も 1 つは  $C_1\sim C_6$  ハロアルキル基を示す。)A は、 $NR_1$ 、O、S、SO または  $SO_2$  を表す( $R_1$  は水素原子、置換基を有してもよい  $C_1\sim C_6$  アルキル基、置換基を有してもよい  $C_2\sim C_6$  アルケニル基、置換基を有してもよい  $C_2\sim C_6$  アルキニル基、置換基を有してもよい  $C_7\sim C_{10}$  アラルキル基、置換基を有してもよいアシル基、置換基を有してもよいカルバモイル基または置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基を示す。) $R_2$  及び  $R_3$  は、それぞれ独立に水素原子、置換基を有してもよい  $C_1\sim C_6$  アルキル基、置換基を有してもよい  $C_7\sim C_{10}$  アラルキル基を示す。 $R_4$  は、水素原子、置換基を有してもよい  $C_1\sim C_{18}$  アルキル基、置換基を有してもよい  $C_3\sim C_8$  シクロアルキル基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいナフチル基、置換基を有してもよい  $C_7\sim C_{10}$  アラルキル基、置換基を有してもよい複素環基、置換基を有してもよいフェノキシ基(ただし、 $-A-(CR_2R_3)_n-R_4$  が $^f-SO_2CH_2CH_2Ophenyl$  である時を除く)、置換基を有してもよいフェニルチオ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基、置換基を有してもよいフェノキシカルボニル基、置換基を有してもよいアラルキルオキシカルボニル基を示し、 $n$  は 0~5 を示す。(但し、 $R^{2a}=H$ 、 $n=1$  で、 $R=C_1\sim C_6$  アルキル基または水素原子、 $R^f=CF_3$ 、 $A=NH$  を表すとき、 $R_2=R_3=H$  を示す。また、 $n=1$  で、 $R$ 、 $R^f$  がアミノ基、モノアルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、アルコキシ基またはアルキルチオ基を示すとき、 $A$  は  $NH$  ではない。)]

$C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl thio group, substituent which is possible to possess  
 $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkoxy group, cyano group, hydroxy group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, halogen atom, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is impossible to possess hydrogen atom, substituent is shown. (However, inside  $R$ ,  $R^f$  and  $R^{<sup>2a</sup>}$ , at least one shows  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ haloalkyl group.) A displays  $NR_{<sub>1</sub>}$ , O, S, SO or  $SO_{<sub>2</sub>}$ , ( $R_{<sub>1</sub>}$  shows alkoxy carbonyl group which is possible to possess carbamoyl group or substituent which is possible to possess acyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkynyl group, substituent which is impossible to possess  $C_{<sub>2</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkenyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent.).  $R_{<sub>2</sub>}$  and  $R_{<sub>3</sub>}$  show  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group, substituent which is possible to respective independence to possess hydrogen atom, substituent. As for  $R_{<sub>4</sub>}$ , phenoxy group which is possible to possess heterocyclic group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>7</sub>}\sim C_{<sub>10</sub>}$ aralkyl group, substituent which is possible to possess naphthyl group, substituent which is possible to possess phenyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>3</sub>}\sim C_{<sub>8</sub>}$ cycloalkyl group, substituent which is possible to possess  $C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>18</sub>}$ alkyl group, substituent which is impossible to possess hydrogen atom, substituent (However, when  $-A-(CR_{<sub>2</sub>})_{<sub>n</sub>-R_{<sub>4</sub>-}SO_2CH_2CH_2Ophenyl$  being you exclude), aralkyloxy carbonyl group which is possible to possess phenoxy carbonyl group, substituent which is possible to possess alkoxy carbonyl group, substituent which is impossible to possess phenylthio group, substituent which is possible to possess substituent showing,  $n$  shows 0 - 5. (However, when with  $R^{<sup>2a</sup>}=H$ ,  $n=1$ , displaying  $R=C_{<sub>1</sub>}\sim C_{<sub>6</sub>}$ alkyl group or hydrogen atom,  $R^f=CF_{<sub>3</sub>}$ ,  $A=NH$ , the  $R_{<sub>2</sub>}=R_{<sub>3</sub>}=H$  is shown. In addition, when with  $n=1$ ,  $R$ ,  $R^f$  shows amino group, monoalkyl amino group, dialkyl amino group, alkoxy group or alkylthio group, A is not NH. ) }

**JP2001247411A**

**2001-9-11**

で表される化合物またはその塩を有効成分とする有害生物防除剤。

【請求項 3】

下記式の 106 個のいずれかの化合物またはその塩。

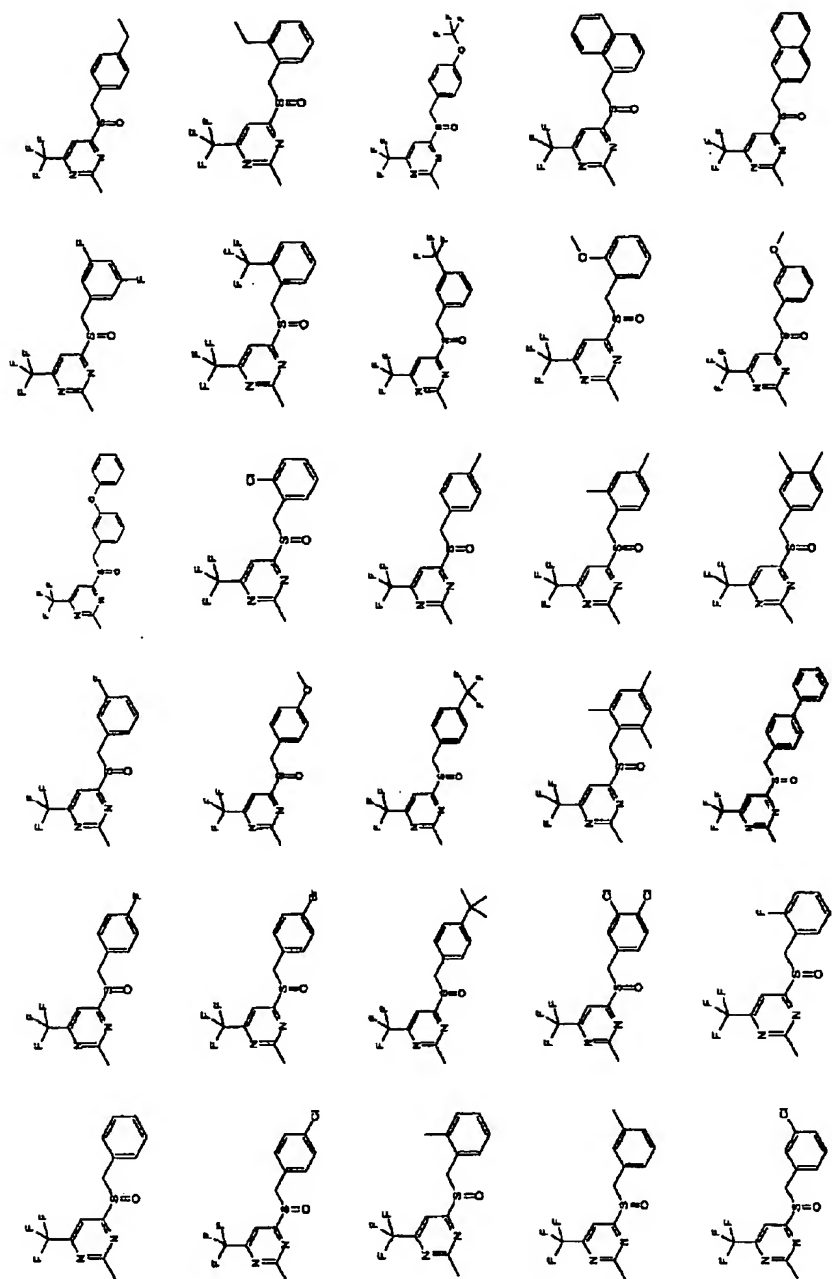
【化 3】

So pest control agent . which designates compound or its salt which is displayed as the active ingredient

[Claim 3]

compound or its salt . of 106 any of below-mentioned formula

[Chemical Formula 3]

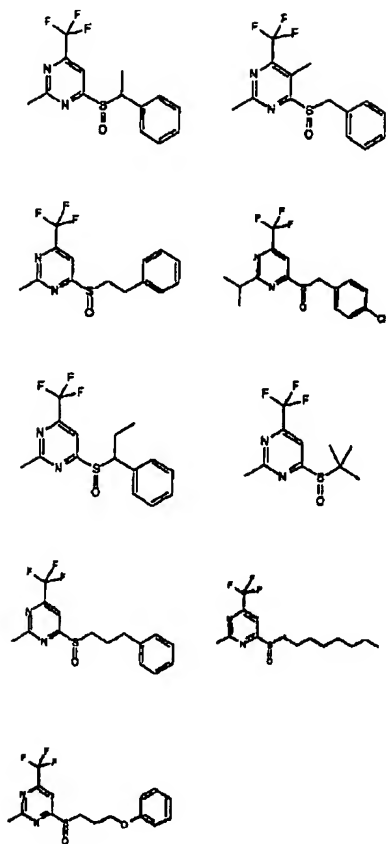


【化 4】

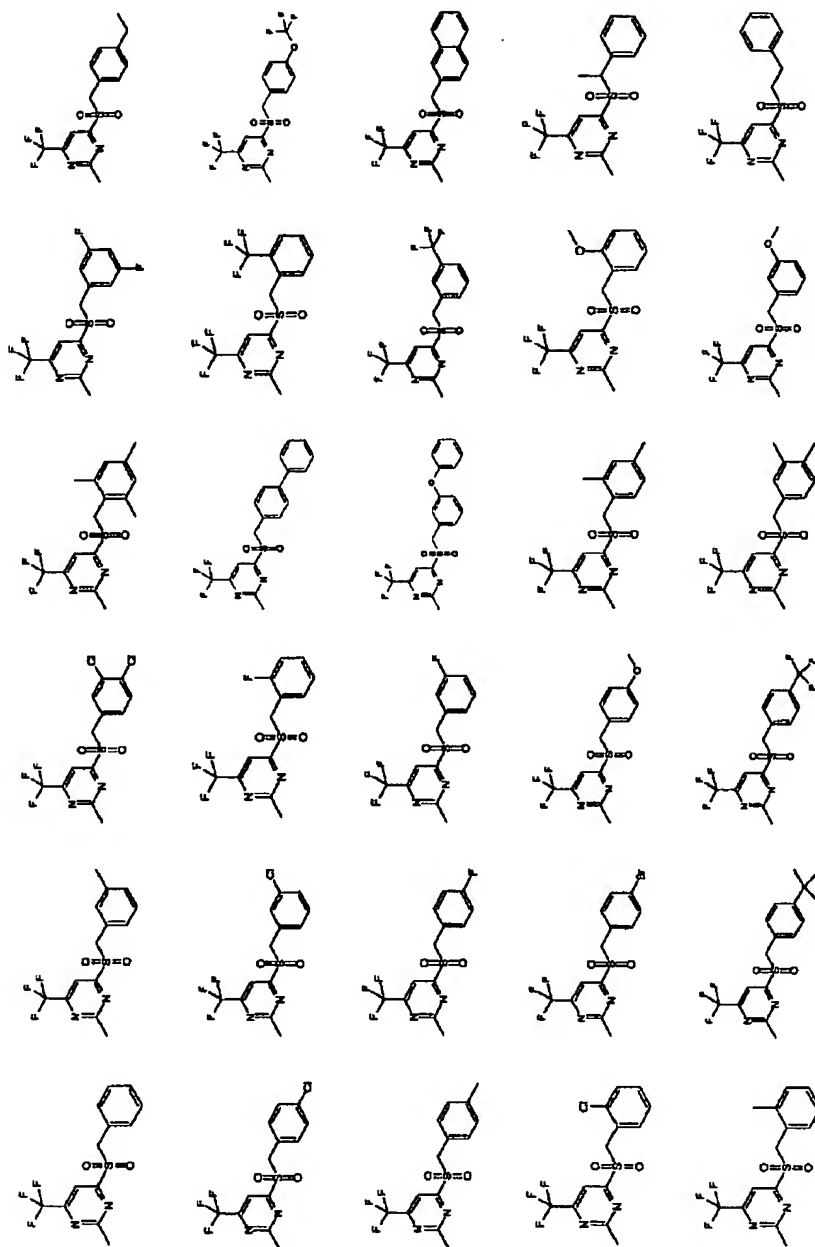
[Chemical Formula 4]



**2001-9-11**

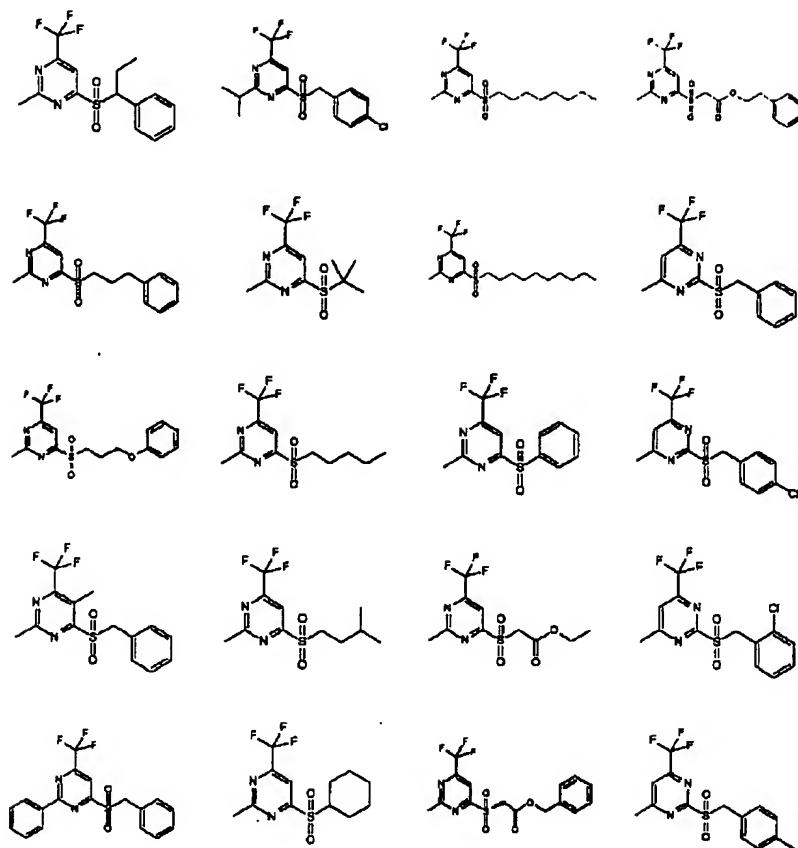


[Chemical Formula 5]



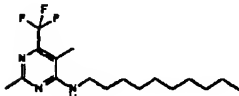
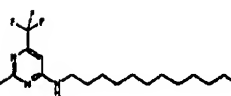
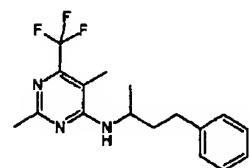
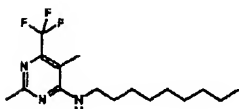
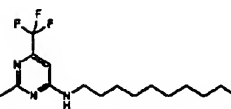
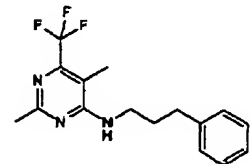
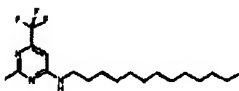
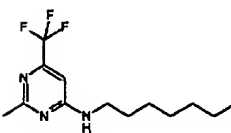
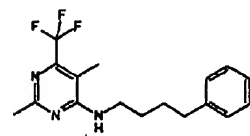
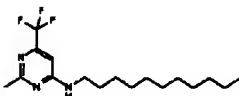
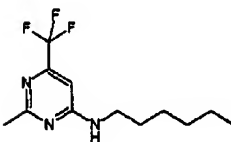
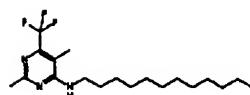
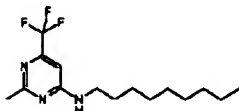
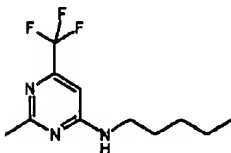
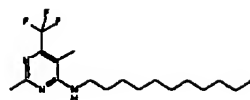
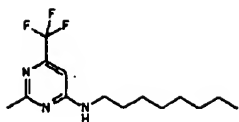
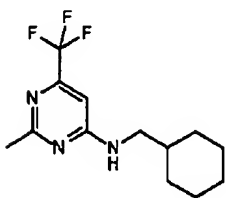
【化 6】

[Chemical Formula 6]



【化 7】

[Chemical Formula 7]

**Specification**

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

[Description of the Invention]

[0001]

[Technological Field of Invention]

本発明は、新規な化合物またはその塩並びに有害生物防除剤に関する。

【0002】

【従来の技術】

特開平 11-246528 号公報には、ピリジン、ピリミジン及びトリアジン系誘導体の除草剤用途が開示されているが、その他の用途については開示されていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、優れた有害生物防除活性を有する化合物及びその塩、並びに有害生物防除剤を提供することを目的とする。

【0004】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは上記目的を達成すべく、新規の化合物について鋭意研究した結果、一般式(I)で表される化合物またはその塩が有害生物防除剤として、公知化合物よりも優れた活性を有することを見出した。

【0005】

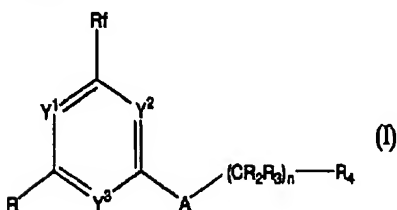
本発明は、下記の化合物およびその塩並びに有害生物防除剤を提供するものである。

【0006】

一般式(I)

【0007】

【化 8】



【0008】

〔式中、Y<sup>1</sup>はNまたはCR<sup>1a</sup>を示し、Y<sup>2</sup>はNまたはCR<sup>2a</sup>を示し、Y<sup>3</sup>はNまたはCR<sup>3a</sup>を示す(R<sup>1a</sup>、R<sup>2a</sup>及びR<sup>3a</sup>は、各々水素原子、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基、置換基を有してもよいC<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>アラルキル基、ハロゲン原子、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ基、シアノ基、水酸基、アミノ基、置換基を有してもよいモノアル

this invention regards novel compound or its salt and pest control agent .

[0002]

[Prior Art]

herbicide application of pyridine , pyrimidine and triazine type derivative is disclosed in Japan Unexamined Patent Publication Hei 11-246528disclosure , butconcerning other application it is not disclosed.

[0003]

[Problems to be Solved by the Invention]

this invention designates that compound and its salt , and pest control agent which possess the pest control activity which is superior are offered as objective .

[0004]

[Means to Solve the Problems]

these inventors in order that above-mentioned objective is achieved, resultof diligent research, compound or its salt which is displayed with General Formula (I )discovered fact that it possesses activity which is superior as pest control agent , in comparison with known compound concerning compound of the novel .

[0005]

this invention is below-mentioned compound and something which offers the its salt and pest control agent .

[0006]

General Formula (I )

[0007]

[Chemical Formula 8]

[0008]

{In Formula, Y<sup>1</sup> shows N or CR<sup>1a</sup>, Y<sup>2</sup> shows N or CR<sup>2a</sup>, Y<sup>3</sup> shows N or CR<sup>3a</sup>, (R<sup>1a</sup>, R<sup>2a</sup> and R<sup>3a</sup> show dialkyl amino group which is possible to possess monoalkyl amino group or substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group ,

キルアミノ基または置換基を有してもよいジアルキルアミノ基を示す;但し、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>及びY<sup>3</sup>の2つがNを示す。〕

## 【0009】

R、Rfは、それぞれ独立に、水素原子、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基、置換基を有してもよいC<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>アラルキル基、ハロゲン原子、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ基、シアノ基、水酸基、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオ基、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、アミノ基、置換基を有してもよいモノアルキルアミノ基、置換基を有してもよいジアルキルアミノ基、置換基を有してもよいアシルアミノ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニルアミノ基、置換基を有してもよいカルバモイルアミノ基を示す(但し、R<sup>1a</sup>、R<sup>2a</sup>及びR<sup>3a</sup>、のいずれか1種及びR及びRfの少なくとも1つはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル基を示す。)

## 【0010】

Aは、NR<sub>1</sub>、O、S、SOまたはSO<sub>2</sub>を表す(R<sub>1</sub>は水素原子、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基、置換基を有してもよいC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル基、置換基を有してもよいC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル基、置換基を有してもよいC<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>アラルキル基、置換基を有してもよいアシル基、置換基を有してもよいカルバモイル基または置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基を示す。)

## 【0011】

R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>は、それぞれ独立に水素原子、置換基を有してもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基、置換基を有してもよいC<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>アラルキル基を示す。

cyano group, hydroxy group, amino group, substituent which is possible to possess  
C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group, halogen atom, substituent which is possible to possess  
C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess each hydrogen atom, substituent,; however, two of the Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup> and Y<sup>3</sup> shows N. ). }

## 【0009】

As for R, Rf, in respective independence, carbamoyl amino group which is possible to possess alkoxy carbonyl amino group, substituent which is possible to possess acyl amino group, substituent which is possible to possess dialkyl amino group, substituent which is possible to possess monoalkyl amino group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfonyl group, amino group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl sulfanyl group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl thio group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group, cyano group, hydroxy group, substituent which is possible to possess C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group, halogen atom, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent is shown, (However, at least one of any 1 kind and R and Rf of the R<sup>1a</sup>, R<sup>2a</sup> and R<sup>3a</sup>, shows C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl group. ).

## 【0010】

A displays NR<sub>1</sub>, O, S, SO or SO<sub>2</sub>, (R<sub>1</sub> shows alkoxy carbonyl group which is possible to possess carbamoyl group or substituent which is possible to possess acyl group, substituent which is possible to possess C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group, substituent which is possible to possess C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl group, substituent which is possible to possess C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent. ).

## 【0011】

R<sub>2</sub> and R<sub>3</sub> show C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which is possible to respective independence to possess hydrogen atom, substituent.

## 【0012】

R<sub>4</sub> は、水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub> アルキル基、置換基を有してもよい C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub> シクロアルキル基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいナフチル基、置換基を有してもよい C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基、置換基を有してもよい複素環基、置換基を有してもよいフェノキシ基 (ただし、-A-(CR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>)<sub>n</sub>-R<sub>4</sub> が -SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ophenyl である時を除く)、置換基を有してもよいフェニルチオ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基、置換基を有してもよいフェノキシカルボニル基、置換基を有してもよいアラルキルオキシカルボニル基を示し、n は 0~5 を示す。

(但し、Y<sup>1</sup>=N、Y<sup>2</sup>=N、R<sup>3a</sup>=H、n=1 で、Rf=C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基または水素原子、R=CF<sub>3</sub>、A=NH を表すとき、R<sub>2</sub>=R<sub>3</sub>=H を示す。)

## 【0013】

また、n=1 で、R、Rf がアミノ基、モノアルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、アルコキシ基またはアルキルチオ基を示すとき、A は NH ではない。

))で表される化合物またはその塩を有効成分とする有害生物防除剤。

## 【0014】

## 【発明の実施の形態】

前記一般式(I)及び(II)において、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup> 及び Y<sup>3</sup> の組合せとしては、Y<sup>1</sup>=N、Y<sup>2</sup>=N、Y<sup>3</sup>=CR<sup>3a</sup>、Y<sup>1</sup>=N、Y<sup>2</sup>=CR<sup>2a</sup>、Y<sup>3</sup>=N; Y<sup>1</sup>=CR<sup>1a</sup>、Y<sup>2</sup>=N、Y<sup>3</sup>=N; が挙げられる。

## 【0015】

n は 0~5、好ましくは 1~5 である。

## 【0016】

R<sup>1a</sup>、R<sup>2a</sup> 及び R<sup>3a</sup> は、好ましくは水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基、ハロゲン原子またはシアノ基を示す。

## 【0012】

As for R<sub>4</sub>, phenoxy group which is possible to possess heterocyclic group, substituent which is possible to possess C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> aralkyl group, substituent which is possible to possess naphthyl group, substituent which is possible to possess phenyl group, substituent which is possible to possess C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> cycloalkyl group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub> alkyl group, substituent which is impossible to possess hydrogen atom, substituent (However, when -A-(CR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>)<sub>n</sub>-R<sub>4</sub> -SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ophenyl being you exclude), aralkyloxy carbonyl group which is possible to possess phenoxy carbonyl group, substituent which is possible to possess alkoxy carbonyl group, substituent which is impossible to possess phenylthio group, substituent which is possible to possess substituent showing, n shows 0 - 5.

(However, when with Y<sup>1</sup>=N, Y<sup>2</sup>=N, R<sup>3a</sup>=H, n=1, displaying Rf =C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl group or hydrogen atom, R=CF<sub>3</sub>, A=NH, the R<sub>2</sub>=R<sub>3</sub>=H is shown.)

## 【0013】

In addition, when with n=1, R, Rf shows amino group, monoalkyl amino group, dialkyl amino group, alkoxy group or alkylthio group, A is not NH.

)) With pest control agent, which designates compound or its salt which is displayed as the active ingredient

## 【0014】

## [Embodiment of the Invention]

You can list Y<sup>1</sup>=N, Y<sup>2</sup>=N, Y<sup>3</sup>=CR<sup>3a</sup>; Y<sup>1</sup>=N, Y<sup>2</sup>=CR<sup>2a</sup>, Y<sup>3</sup>=N; Y<sup>1</sup>=CR<sup>1a</sup>, Y<sup>2</sup>=N, Y<sup>3</sup>=N; as combination of the: Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup> and Y<sup>3</sup> in aforementioned General Formula (I) and (II).

## 【0015】

n 0 - 5, is preferably 1~5.

## 【0016】

R<sup>1a</sup>, R<sup>2a</sup> and R<sup>3a</sup> show C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy group, halogen atom or cyano group which is possible to possess C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl group, substituent which is possible to possess preferably hydrogen atom,

【0017】

好ましい R、R<sub>f</sub> は、水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、アミノ基、置換基を有してもよいアシルアミノ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニルアミノ基、置換基を有してもよいカルバモイルアミノ基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基である。

【0018】

好ましい A は、NR<sub>1</sub>、SO 及び SO<sub>2</sub> である。

【0019】

R<sub>1</sub> は、好ましくは、水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、置換基を有してもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル基、置換基を有してもよい C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニル基、置換基を有してもよいアシル基、置換基を有してもよいカルバモイル基および置換基を有してもよいアルコキシカルボニル基である。

【0020】

好ましい R<sub>2</sub> 及び R<sub>3</sub> は、水素原子、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル基である。

【0021】

好ましい R<sub>4</sub> は、水素原子、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub> アルキル基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいナフチル基、置換基を有してもよい複素環基、置換基を有してもよいフェノキシ基である。

【0022】

上記各置換基において、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基としては、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシルなどの直鎖または分枝を有するアルキル基が挙げられる。

【0023】

C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub> アルキル基としては、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、

substituent .

【0017】

Desirable R, R<sub>f</sub> is C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group which is possible to possess the carbamoyl amino group, substituent which is possible to possess alkoxy carbonyl amino group, substituent which is possible to possess acyl amino group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, amino group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent .

【0018】

Desirable A is NR<sub>1</sub>, SO and SO<sub>2</sub>.

【0019】

R<sub>1</sub> is alkoxy carbonyl group which is possible to possess carbamoyl group and the substituent which are possible to possess acyl group, substituent which is possible to possess C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl group, substituent which is possible to possess C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess preferably, hydrogen atom, substituent .

【0020】

Desirable R<sub>2</sub> and R<sub>3</sub> are hydrogen atom, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl group .

【0021】

Desirable R<sub>4</sub> is phenoxy group which is possible to possess the heterocyclic group, substituent which is possible to possess naphthyl group, substituent which is possible to possess phenyl group, substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>alkyl group, substituent which is possible to possess hydrogen atom, substituent .

【0022】

You can list alkyl group which possesses methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, pentyl, hexyl or other straight chain or branch as the C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group in above-mentioned each substituent .

【0023】

As C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>alkyl group, you can list alkyl group which possesses methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, pentyl, hexyl, heptyl, octyl, nonyl, decyl, undecyl, dodecyl,



ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシルなどの直鎖または分枝を有するアルキル基が挙げられる。

【0024】

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシなどの直鎖または分枝を有する炭素数 1~6 のアルコキシ基が挙げられる。

【0025】

置換基を有する C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、置換基を有する C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub> アルキル基、置換基を有する C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基、置換基を有するアルケニル基、置換基を有する C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニル基、置換基を有する C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub> シクロアルキル基、置換基を有するアルコキシカルボニル基、置換基を有するモノアルキルアミノ基、置換基を有するジアルキルアミノ基、置換基を有する C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルチオ基などの置換基としては、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルチオ、シアノ、ニトロ、アミノ基、水酸基などが挙げられる。

【0026】

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルケニル基としては、ビニル基、アリル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

【0027】

C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub> アルキニル基としては、エチニル基、2-プロピニル(プロパルギル)基、1-メチル-2-プロピニル基等が挙げられる。

【0028】

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

【0029】

C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基としては、2-フェニルエチル、ベンジル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル等のアラルキル基が挙げられる。

【0030】

tridecyl, tetradecyl, pentadecyl, hexadecyl, heptadecyl, octadecyl or other straight chain or the branch.

【0024】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group, you can list alkoxy group of carbon number 1~6 which possesses the methoxy, ethoxy, n-propoxy, isopropoxy, n-butoxy, isobutoxy, s-butoxy, t-butoxy, pentyloxy, hexyloxy or other straight chain or branch.

【0025】

You can list halogen, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkoxy, C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl thio, cyano, nitro, amino group, hydroxy group etc as C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl thio group or other substituent which possesses dialkyl amino group, substituent which possesses monoalkyl amino group, substituent which possesses alkoxy carbonyl group, substituent which possesses C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>cycloalkyl group, substituent which possesses C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl group, substituent which possesses alkenyl group, substituent which possesses C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkoxy group, substituent which possesses C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>alkyl group, substituent which possesses the C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group, substituent which possesses substituent.

【0026】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkenyl group, you can list vinyl group, allyl group, 3-butenyl group etc.

【0027】

As C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>alkynyl group, ethynyl group, 2-propynyl (propargyl) group, you can list 1-methyl-2-propynyl group etc.

【0028】

As halogen atom, you can list fluorine atom, chlorine atom, bromine atom, iodine atom.

【0029】

As C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group, you can list 2-phenylethyl, benzyl, 1-phenylethyl, 3-phenylpropyl, 4-phenylbutyl or other aralkyl group.

【0030】

モノアルキルアミノ基としては、前記の  $C_1\sim C_6$  アルキル基でモノ置換されたアミノ基が挙げられる。

【0031】

ジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ等の前記の  $C_1\sim C_6$  アルキル基でジ置換されたアミノ基が挙げられる。

【0032】

アシルアミノ基としては、ホルミルアミノ、ベンゾイルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、n-ブチルアミノなどの炭素数 1~8 のアシルアミノ基が挙げられる。

【0033】

$C_1\sim C_6$  アルキルチオ基としては、-S-( $C_1\sim C_6$  アルキル基)が挙げられる( $C_1\sim C_6$  アルキル基は、前記に同じ)。

【0034】

複素環基としてはピペリジル、フリル、チエニル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピロリル、ピロリジニル、トリアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、インドリル、ピラゾリル、ピリダジニル、シノリニル、キノリル、イソキノリル、キノキサリニル、ピラジニル、ピリジル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル、テトラゾリル等が挙げられる。

【0035】

置換基を有してもよいアシル基としては、ホルミル、アセチル、プロピオニル、n-ブチル、イソブチル、バレリル、イソバレリル、ピバロイルなどの直鎖又は分枝を有する炭素数 1~6 のアシル基、ベンゾイル及び置換アシル基が挙げられる。

置換基を有するアシル基としては、クロロアセチル基、ブromoアセチル基、ジクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基等の置換アセチル基、メトキシアセチル基、エトキシアセチル基等のアルコキシ置換アセチル基、メチルチオアセチル基等のアルキルチオ置換アセチル基、フェノキシアセチル基、フェニルチオアセチル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、4-t-ブチルベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、4-シアノベンゾイル基、4-ニトロベンゾイル基等の置換ベンゾイル基が挙げられる。

As monoalkyl amino group, you can list amino group which monosubstituted is done with the aforementioned  $C_1\sim C_6$  alkyl group.

[0031]

As dialkyl amino group, you can list amino group which disubstituted is done with the dimethylamino, diethyl amino, di-n-propylamino, diisopropyl amino, dibutyl amino, dipentyl amino, dihexyl amino or other aforementioned  $C_1\sim C_6$  alkyl group.

[0032]

As acyl amino group, you can list acyl amino group of formyl amino, benzoyl amino, acetylamino, propanoyl amino, n-butyl amino or other carbon number 1~8.

[0033]

As  $C_1\sim C_6$  alkyl thio group, -S- you can list ( $C_1\sim C_6$  alkyl group), (As for  $C_1\sim C_6$  alkyl group, same to description above).

[0034]

bipyridyl, furil, thienyl, imidazolyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrrolyl, pyrrolidinyl, triazolyl, benzo thiazolyl, benzoimidazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, indolyl, pyrazolyl, pyridazinyl, [shinorinir], you can list quinolyl, isoquinolyl, quinoxaliny, pyrazinyl, pyridyl, benzo furil, benzo thienyl, tetrazolyl etc as heterocyclic group.

[0035]

formyl, acetyl, propanoyl, n-butyl, [izobuchirir], you can list acyl group, benzoyl and substituted acyl group of carbon number 1~6 which possesses valeryl, isovaleryl, pivaloyl or other straight or branched as acyl group which is possible to possess the substituent.

You can list chloroacetyl group, bromo acetyl group, dichloroacetyl group, trifluoroacetyl group or other substitution acetyl group, methoxy acetyl group, ethoxy acetyl group or other alkoxy-substituted acetyl group, methylthio acetyl group or other alkyl thio substitution acetyl group, phenoxy acetyl group, phenylthio acetyl group, 2-chlorobenzoyl group, 3-chlorobenzoyl group, 4-chlorobenzoyl group, 4-methyl benzoyl group, 4-t-butyl benzoyl group, 4-methoxy benzoyl group, 4-cyano benzoyl group, 4-nitrobenzoyl group or other substituted benzoyl basis etc as acyl group which possesses substituent.

換ベンゾイル基などが挙げられる。

【0036】

C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub> シクロアルキル基としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルが挙げられる。

【0037】

置換基を有してもよいカルバモイル基としては、CONH<sub>2</sub>、CONH(炭素数 1~6 のアルキル)、CON(炭素数 1~6 のアルキル)<sub>2</sub>などが挙げられる。

【0038】

置換基を有してもよいカルバモイルアミノ基としては、-NHCONH<sub>2</sub>、-NHCONH(炭素数 1~6 のアルキル)、-NHCON(炭素数 1~6 のアルキル)<sub>2</sub>などが挙げられる。

【0039】

アルコキシカルボニル基としては、メキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニルなどの直鎖または分枝を有する炭素数 2~7 のアルコキシカルボニル基が挙げられる。

【0040】

アルコキシカルボニルアミノ基としては、メキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、n-プロポキシカルボニルアミノ、イソプロポキシカルボニルアミノ、n-ブトキシカルボニルアミノ、イソブトキシカルボニルアミノ、sec-ブトキシカルボニルアミノ、tert-ブトキシカルボニルアミノ、ペンチルオキシカルボニルアミノ、ヘキシルオキシカルボニルアミノなどの直鎖または分枝を有する炭素数 2~7 のアルコキシカルボニルアミノ基が挙げられる。

【0041】

アラルキルオキシカルボニル基としては、-COO(C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基;C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基は前記に同じ)が挙げられる。

【0042】

ハロゲンで置換された C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル基としては、  
モノフルオロメチル、

【0036】

As C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>cycloalkyl group, you can list cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl, cyclooctyl.

【0037】

CONH<sub>2</sub>, CONH (alkyl of carbon number 1~6), you can list CON (alkyl of carbon number 1~6) etc as carbamoyl group which is possible to possess substituent.

【0038】

-NHCONH<sub>2</sub>, -NHCONH (alkyl of carbon number 1~6), -NHCON you can list (alkyl of carbon number 1~6) etc as carbamoyl amino group which is possible to possess substituent.

【0039】

As alkoxy carbonyl group, you can list alkoxy carbonyl group of carbon number 2~7 which possesses the methoxycarbonyl, ethoxy carbonyl, n-propoxy carbonyl, isopropoxy carbonyl, n-butoxy carbonyl, isobutoxy carbonyl, s-butoxy carbonyl, t-butoxy carbonyl, pentyloxy carbonyl, hexyloxy carbonyl or other straight chain or branch.

【0040】

As alkoxy carbonyl amino group, you can list alkoxy carbonyl amino group of carbon number 2~7 which possesses the methoxycarbonylamino, ethoxy carbonyl amino, n-propoxy carbonyl amino, isopropoxy carbonyl amino, n-butoxy carbonyl amino, isobutoxy carbonyl amino, s-butoxy carbonyl amino, t-butoxy carbonyl amino, pentyloxy carbonyl amino, hexyloxy carbonyl amino or other straight chain or branch.

【0041】

As aralkyloxy carbonyl group, -COO you can list (As for C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group;C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub>aralkyl group same to description above).

【0042】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>haloalkyl group which is substituted with halogen, mono fluoromethyl,

ジフルオロメチル、  
 トリフルオロメチル、  
 1-フルオロエチル、  
 2-フルオロエチル、  
 1,1-ジフルオロエチル、  
 1,2-ジフルオロエチル、  
 2,2-ジフルオロエチル、  
 2,2,2-トリフルオロエチル、  
 1,2,2-トリフルオロエチル、  
 1,1,2-トリフルオロエチル、  
 1,1,2,2-テトラフルオロエチル、  
 1,2,2,2-テトラフルオロエチル、  
 ペンタフルオロエチル、  
 1-フルオロプロピル、  
 2-フルオロプロピル、  
 3-フルオロプロピル、  
 1,1-ジフルオロプロピル、  
 1,2-ジフルオロプロピル、  
 1,3-ジフルオロプロピル、  
 2,2-ジフルオロプロピル、  
 2,3-ジフルオロプロピル、  
 3,3-ジフルオロプロピル、  
 1,1,2-トリフルオロプロピル、  
 1,1,3-トリフルオロプロピル、  
 1,2,2-トリフルオロプロピル、1,2,3-トリフルオロプロピル、1,3,3-トリフルオロプロピル、2,2,3-トリフルオロプロピル、2,3,3-トリフルオロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、1,3,3,3-テトラフルオロプロピル、1,2,3,3-テトラフルオロプロピル、1,1,2,3-テトラフルオロプロピル、1,1,3,3-テトラフルオロプロピル、1,1,2,3-テトラフルオロプロピル、1,1,2,2-テトラフルオロプロピル、1,1,2,3-ペンタフルオロプロピル、1,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、1,2,2,3,3-ペンタフルオロプロピル、1,1,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、1,1,2,2,3-ペンタフルオロプロピル、1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-フルオロプロパ

difluoromethyl ,  
 trifluoromethyl ,  
 1 -fluoro ethyl ,  
 2 -fluoro ethyl ,  
 1 and 1 -difluoro ethyl ,  
 1 and 2 -difluoro ethyl ,  
 2 and 2 -difluoro ethyl ,  
 2, 2 and 2 -trifluoroethyl ,  
 1, 2 and 2 -trifluoroethyl ,  
 1, 1 and 2 -trifluoroethyl ,  
 1, 1, 2 and 2 -tetrafluoroethyl ,  
 1, 2, 2 and 2 -tetrafluoroethyl ,  
 pentafluoroethyl ,  
 1 -fluoropropyl ,  
 2 -fluoropropyl ,  
 3 -fluoropropyl ,  
 1 and 1 -difluoro propyl ,  
 1 and 2 -difluoro propyl ,  
 1 and 3 -difluoro propyl ,  
 2 and 2 -difluoro propyl ,  
 2 and 3 -difluoro propyl ,  
 3 and 3 -difluoro propyl ,  
 1, 1 and 2 -trifluoropropyl ,  
 1, 1 and 3 -trifluoropropyl ,

You can list C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>alkyl group where 1, 2 and 2 -trifluoropropyl , 1, 2, 3- trifluoropropyl , 1, 3, 3- trifluoropropyl , 3, 3, 3- trifluoropropyl , 2, 2, 3- trifluoropropyl , 2, 3, 3- trifluoropropyl , 2, 3, 3, 3- tetrafluoropropyl , 2, 2, 3, 3- tetrafluoropropyl , 1, 3, 3, 3- tetrafluoropropyl , 1, 2, 3, 3- tetrafluoropropyl , 1, 2, 2, 3- tetrafluoropropyl , 1, 1, 3, 3- tetrafluoropropyl , 1, 1, 2, 3- tetrafluoropropyl , 1, 1, 2, 2- tetrafluoropropyl , 2, 2, 3, 3, 3- pentafluoropropyl , 1, 2, 3, 3, 3- pentafluoropropyl , 1, 2, 2, 3, 3- pentafluoropropyl , 1, 1, 3, 3, 3- pentafluoropropyl , 1, 1, 2, 3, 3- pentafluoropropyl , 1, 1, 2, 2, 3- pentafluoropropyl , 1, 2, 3, 3, 3- hexafluoropropyl , 1, 1, 2, 3, 3, 3- hexafluoropropyl , 1, 1, 2, 2, 3, 3- hexafluoropropyl , heptafluoro propyl , 1- fluoro propane -2- yl , 2- fluoro propane -2- yl , 1, 1- difluoro propane -2- yl , 1, 2- difluoro propane -2- yl , 1, 3- difluoro propane -2- yl , 1, 1, 1- trifluoro propane -2- yl , 1, 1, 2- trifluoro propane -2- yl , 1, 2, 3-

ン-2-イル、2-フルオロプロパン-2-イル、1,1-ジフルオロプロパン-2-イル、1,2-ジフルオロプロパン-2-イル、1,3-ジフルオロプロパン-2-イル、1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル、1,1,2-トリフルオロプロパン-2-イル、1,2,3-トリフルオロプロパン-2-イル、1,1,3-トリフルオロプロパン-2-イル、1,1,1,2-テトラフルオロプロパン-2-イル、1,1,2,3-テトラフルオロプロパン-2-イル、1,1,1,3-テトラフルオロプロパン-2-イル、1,1,1,2,3-ペンタフルオロプロパン-2-イル、1,1,1,3,3-ペンタフルオロプロパン-2-イル、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-イル、1,1,1,2,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-イル、ヘプタフルオロプロパン-2-イル、パーフルオロブチル、パーフルオロペンチル、パーフルオロヘキシルなどの、水素原子の少なくとも1個がハロゲン原子で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基が挙げられる。

## 【0043】

C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ基としては、-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル基)が挙げられる(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル基は、前記に同じ)。

## 【0044】

置換基を有する(フェニル基、複素環基、C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> アラルキル基、ナフチル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、フェノキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基)の置換基の数は、1~5 個、好ましくは 1~3 個である。

該置換基としては、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキル基、ハロゲン原子、水酸基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルコキシ基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルチオ基、ニトロ基、アミノ基、アシルアミノ基、シアノ基、アシル基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> ハロアルキル基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニルオキシ基、置換基(ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基など)を有していてもよいアラルキルオキシ基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいアルキルアミノ基、置換基を有してもよいフェノキシ基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル基、置換基を有してもよい C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> アルキルスルホニル基、置換基を有してもよいアシルアミノ基、置換基を有してもよいアルコキシカルボニルアミノ基等が挙げられる。

trifluoro propane -2- yl , 1, 1, 3- trifluoro propane -2- yl , 1, 1, 1, 2- tetrafluoro propane -2- yl , 1, 1, 2, 3- tetrafluoro propane -2- yl , 1, 1, 1, 3- tetrafluoro propane -2- yl , 1, 1, 3, 3- tetrafluoro propane -2- yl , 1, 1, 1, 2, 3- pentafluoropropane -2- yl , 1, 1, 1, 3, 3- pentafluoropropane -2- yl , 1, 1, 2, 3, 3- pentafluoropropane -2- yl , 1, 1, 1, 3, 3, 3- hexafluoropropane -2- yl , 1, 1, 1, 2, 3, 3- hexafluoropropane -2- yl , heptafluoropropane -2- yl , perfluorobutyl , perfluoropentyl , perfluorohexyl or other , hydrogen atom at least one is substituted with halogen atom .

## 【0043】

As C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy group , -O- you can list (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl group) , (As for C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl group , same to description above).

## 【0044】

number of substituents of (phenyl group , heterocyclic group , C<sub>7</sub>~C<sub>10</sub> aralkyl group , naphthyl group , phenoxy group , phenylthio group , phenoxy carbonyl group , aralkyloxy carbonyl group ) which possesses substituent , 1 - 5 , is preferably 1~3 .

As said substituent , you can list alkoxy carbonyl amino group etc which is possible to possess acyl amino group , substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl group , substituent which is possible to possess C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfinyl group , substituent which is possible to possess phenoxy group , substituent which is possible to possess alkyl amino group , substituent which is possible to possess phenyl group , substituent which is possible to possess aralkyloxy group , substituent which is possible to have possessed C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl group , halogen atom , hydroxy group , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkoxy group , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkoxy group , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl thio group , nitro group , amino group , acyl amino group , cyano group , acyl group , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> haloalkyl group , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyl amino group , C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> alkyl sulfonyloxy group , substituent (Such as halogen atom , lower alkyl group , lower

【0045】

上記置換基のうち、 $C_1\sim C_6$ アルキル基、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル基、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ基、アシルアミノ基、アシル基としては前記の通りである。

$C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ基としては、 $-NHSO_2-(C_1\sim C_6)$ アルキル基が挙げられ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ基としては、 $-O-SO_2-(C_1\sim C_6)$ アルキル基が挙げられ、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル基としては $-SO-$ (置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキル)が挙げられ、置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル基としては $-SO_2-$ (置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルキル)が挙げられ、置換基を有してもよいアシルアミノ基としては $-NH-$ (置換基を有してもよいアシル)が挙げられ、置換基を有してもよいアルコキシカルボニルアミノ基としては $-NH-$ (置換基を有してもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル)が挙げられ(但し、 $C_1\sim C_6$ アルキル基は前記に同じ)、アラルキルオキシ基としてはベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などが挙げられる。

【0046】

一般式(I)で示される化合物は、 $R^2$ と $R^3$ が互いに異なる場合に不斉炭素を持ち得ることもあるが、これはRS法によって記載する。

特記しない場合には混合物であるか、不斉炭素が存在しないことを示す。

光学異性体が存在する場合、本発明は、R体、S体およびラセミ混合物のいずれをも包含する。

光学異性体の分離は、光学活性な充填剤を使用したカラムクロマトグラフィー、光学活性な酸性化合物との塩形成等の常法に従い行うことができる。

【0047】

本発明の化合物の塩としては、塩酸、硫酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硝酸、過塩素酸などの無機酸、パラトルエンスルホン酸、メタンスルホン酸などの有機酸との塩が挙げられるが、こ

alkoxy group).

【0045】

Aforementioned sort is among above-mentioned substituent, as  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl group,  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ haloalkyl group, halogen atom,  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkoxy group,  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ haloalkoxy group, acyl amino group, acyl group.

As  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl sulfonyl amino group, as acyl amino group where  $-NHSO_2-$  you can list ( $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl group),  $-O-SO_2-$  you can list ( $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl group) as  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl sulfonyloxy group,  $-SO-$  you can list ( $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl which is possible to possess substituent) as the  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl sulfinyl group which is possible to possess substituent,  $-SO_2-$  you can list the( $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl which is possible to possess substituent) as  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl sulfonyl group which is possible to possess substituent, is possible to possess substituent  $-NH-$  listing (acyl which is possible to possess substituent),  $-NH-$  you can list ( $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkoxy carbonyl which is possible to possess substituent) as alkoxy carbonyl amino group which is possible to possess substituent and (However, as for  $C_{1-6}\sim C_{1-6}$ alkyl group same to description above), you can list benzyloxy group, phenethyl oxy group etc as aralkyloxy group.

【0046】

When  $R^{2,3}$  differ mutually, can having asymmetric carbon there is a compound which is shown with General Formula (I), but it states this with RS method.

When you do not specially mention, it is a mixture, or fact that the asymmetric carbon does not exist is shown.

When optical isomer exists, this invention includes in each case of R-isomer, S-isomer and racemic mixture.

Can separate optical isomer, to do in accordance with salt formation or other conventional method of the column chromatography, optically active acidic compound which uses optically active filler.

【0047】

As salt of compound of this invention, you can list salt of the hydrochloric acid, sulfuric acid, hydrobromic acid, hydroiodic acid, nitric acid, perchloric acid or other inorganic acid, p-toluenesulfonic acid, methane sulfonic acid

れらに限定されない。

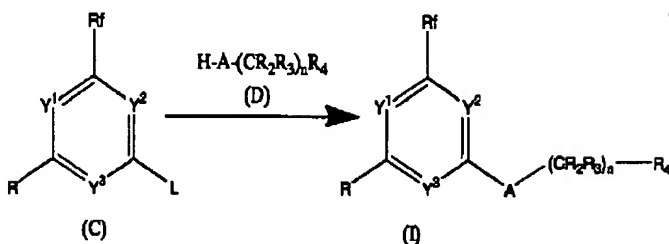
該塩は、常法に従い遊離塩基と酸を用いて製造される。

【0048】

一般式(I)で示される化合物は、一般的に、下記の反応式

【0049】

【化 9】



【0050】

〔式中、 $Y^1, Y^2, Y^3, R, R_f, A, R_2, R_3, R_4$  および  $n$  は、前記に定義した通りである。L は、ハロゲン原子、アルキルチオ基、メタンスルホニル基、トルエンスルホニル基などの脱離基を示す。〕に従い、一般式(C)の化合物を、必要に応じて塩基の存在下に一般式(D)の化合物と反応させることにより得ることができる。

【0051】

具体的には、ピリミジン環に結合した適当な脱離基を有する化合物(C)1 モルに対し、化合物(D)を 1 モル程度、塩基を使用する場合には、1 モル～過剰量用い、溶媒の存在下又は非存在下に室温から反応系の還流する温度で 1~24 時間反応させることにより、目的とする一般式(I)の化合物を得る。

塩基としては、金属ナトリウム、NaOMe、NaOEt、NaO<sup>t</sup>Bu などのナトリウムアルコキシド、NaH、ブチリチウム、水酸化ナトリウム、トリエチルアミン、ジメチルアミノピリジン、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウムなどが挙げられる。

【0052】

A が NR<sub>1</sub>(R<sub>1</sub> はアシル基、カルバモイル基、アルコキシカルボニル基)である本発明の化合物(I'')は、下記の反応式

or other organic acid , but it is not limited in these.

said salt is produced making use of free base and acid in accordance with conventional method .

【0048】

compound which is shown with General Formula ( I ) general, thebelow-mentioned reaction scheme

【0049】

[Chemical Formula 9]

【0050】

It can acquire in accordance with {In Formula,  $Y^{<sup>1</sup>}, Y^{<sup>2</sup>}, Y^{<sup>3</sup>}, R, R_f, A, R^{<sub>2</sub>}, R^{<sub>3</sub>}, R^{<sub>4</sub>}$  and  $n$  are, as defined on descriptionabove. L shows halogen atom , alkyl thio group , methane sulfonyl group , toluene sulfonyl group or other leaving group . }, compound of General Formula ( C ),by reacting with compound of General Formula ( D ) under existing of the according to need base .

【0051】

Concretely, compound of General Formula ( I ) which is made objective by 1 -24 hours reacting with temperature which when 1 mole extent , base is used, in the presense or absence of 1 mole ~excess quantity using and solvent reflux of reaction system does the compound ( D ) from room temperature compound which possesses suitable leaving group which isconnected to pyrimidine ring ( C ) vis-a-vis 1 mole , is obtained.

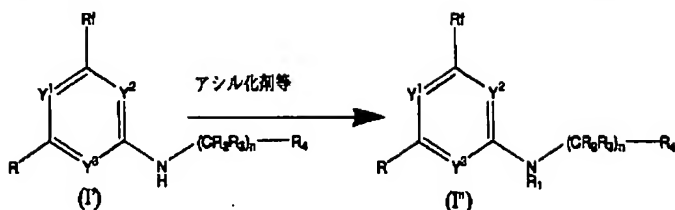
As base , you can list metallic sodium , NaOMe, NaOEt, NaO-<sup>t</sup>Bu or other sodium alkoxide , NaH, butyl lithium , sodium hydroxide , triethylamine , dimethylamino pyridine , potassium carbonate , sodium carbonate , sodium hydrogen carbonate etc.

【0052】

As for compound ( I'') of this invention where A is NR<sub>1</sub> (As for R<sub>1</sub> acyl group , carbamoyl group , alkoxy carbonyl group ), thebelow-mentioned reaction scheme

【0053】

【化 10】



【0054】

〔式中、 $Y^1, Y^2, Y^3, R, R_f, R_2, R_3, R_4$  および  $n$  は、前記に定義した通りである。 $R_1$  はアシル基、カルバモイル基、アルコキシカルボニル基を示す〕に従い、一般式(I')の化合物をアシル化剤等(カルバモイル化剤、アルコキシカルボニル化剤を含む)と触媒の存在下あるいは非存在下に反応させることにより得ることができる。

触媒としては、1~数滴の濃硫酸等の酸触媒、三フッ化ホウ素エーテル錯体等のルイス酸触媒、ナトリウムアルコキシド、NaH、及びトリエチルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、DBU、DBN等の有機塩基が挙げられる。

【0055】

具体的には、化合物(I') 1 モルに対し、アシル化剤等を 1 モルから過剰量加え、氷冷下から反応系の還流する程度の温度で 1~24 時間反応させることにより、一般式(I'')の化合物が得られる。

【0056】

一般式(I)の化合物は、より具体的には、例えば下記反応工程式 1~2 によって製造できるが、これらの方法に限定されるものではない。

【0057】

【化 11】

【0053】

[Chemical Formula 10]

【0054】

In accordance with {In Formula,  $Y^{<sup>1</sup>}, Y^{<sup>2</sup>}, Y^{<sup>3</sup>}, R, R_f, R^{<sub>2</sub>}, R^{<sub>3</sub>}, R^{<sub>4</sub>}$  and  $n$  are, as defined on description above.  $R^{<sub>1</sub>}$  shows acyl group, carbamoyl group, alkoxy carbonyl group }, compound of General Formula (I') can be acquired by (carbamoyl conversion agent, alkoxy carbonylation agent is included.) with such as acylation agent reacting under existing of catalyst or under absence.

As catalyst, you can list concentrated sulfuric acid or other acid catalyst, boron trifluoride ether complex or other Lewis acid catalyst, sodium alkoxide, NaH, and triethylamine, pyridine, dimethylamino pyridine, DBU, DBN or other organic base of 1 - several drops.

【0055】

Concretely, acylation agent etc excess quantity is added from 1 mole compound (I') vis-a-vis 1 mole, compound of General Formula (I'') is acquired reflux of reaction system by 1 - 24 hours reacting with temperature of extent which is done from under ice cooling.

【0056】

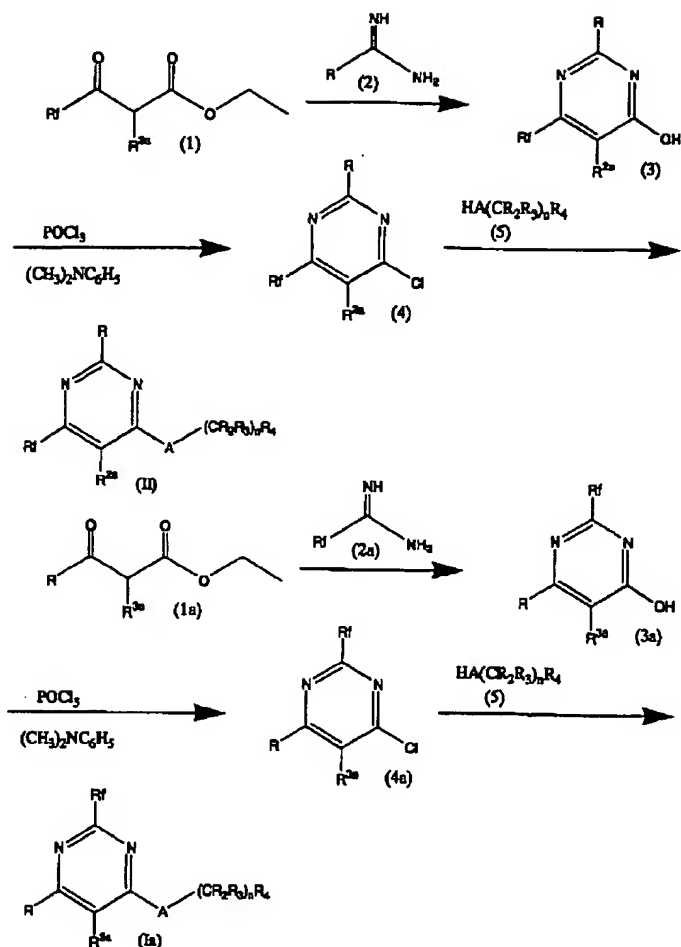
More concretely, it can produce compound of General Formula (I), with the for example below-mentioned reaction step scheme 1~2, but it is not something which is limited in these method.

&lt;reaction step scheme 1&gt;

【0057】

[Chemical Formula 11]





【0058】

[式中  $\text{R}$ 、 $\text{R}_2$ 、 $\text{R}_3$ 、 $\text{R}_4$ 、 $\text{R}^{2a}$ 、 $\text{R}^{3a}$ 、 $\text{R}_f$ 、 $\text{A}$  及び  $n$  は前記に同じ。]

$\beta$ -ケトエステル化合物(1)をアミジン(2)と溶媒中塩基の存在下に反応させて、ピリミジン誘導体(3)を得る。

反応は、化合物(1)1 モルに対し、化合物(2)を 1 モル程度、塩基を 1 モルから 2 モル程度用い、室温から溶媒の還流する温度下に 1~24 時間反応させることにより有利に進行する。

塩基としては、ナトリウムアルコキッド、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等が挙げられる。

溶媒としては、メタノール、エタノールなどのアルコール、THF、ジエチルエーテルなどのエーテル

[0058]

[As for  $\text{R}$ ,  $\text{R}_{\text{sub}2}$ ,  $\text{R}_{\text{sub}3}$ ,  $\text{R}_{\text{sub}4}$ ,  $\text{R}_{\text{sup}2a}$ ,  $\text{R}_{\text{sup}3a}$ ,  $\text{R}_f$ ,  $\text{A}$  and  $n$  in Formula same to description above. ]

The  $\beta$ -keto ester compound (1) amidine (2) with reacting under existing of the base in solvent, you obtain pyrimidine derivative (3).

compound (1) vis-a-vis 1 mole, compound (2) 1 mole extent, base 2 mole extent it uses reaction, from 1 mole, it advances profitably reflux of solvent by 1 - 24 hours reacting under temperature which is done from room temperature.

As base, you can list sodium alkoxide, sodium hydride, sodium hydroxide, potassium carbonate etc.

As solvent, you can list methanol, ethanol or other alcohol, THF, diethyl ether or other ethers, DMF, DMSO etc.

類、DMF、DMSO 等が挙げられる。

【0059】

次にピリミジン誘導体(3)をオキシ塩化リンと塩基の存在下に反応させて、塩素化合物(4)を得る。

反応は、希釈溶媒存在下あるいは無溶媒でピリミジン誘導体(3)1 モルに対しオキシ塩化リンを 1 モルから過剰量、塩基を触媒量から過剰量使用し、室温から反応系の還流する温度下に 1~24 時間反応させることにより有利に進行する。

塩基としては、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンなどが用いられる。

【0060】

得られた化合物(4)を、化合物(5)と溶媒中塩基の存在下に反応させて、一般式(II)の化合物を得る。

反応は、化合物(4)1 モルに対し、化合物(5)を 1 モルから 2 モル程度、塩基を 1 モルから過剰量用い、室温から溶媒の還流する温度下に 1~24 時間反応させることにより有利に進行する。

塩基としては、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、ナトリウムアルコキシド、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム、DBU、DBN などが用いられる。

溶媒としては、THF、ジエチルエーテルなどのエーテル類、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素、DMF、DMSO 等が挙げられる。

【0061】

化合物(1)および化合物(2)の R と R<sub>f</sub> を交換した原料化合物(1a)及び化合物(2a)を用い、上記と同様に反応させることで、化合物(3a)、化合物(4a)を経由して R と R<sub>f</sub> を交換した一般式(Ia)の化合物を得ることができる。

【0062】

【化 12】

THF , diethyl ether or other ethers , DMF , DMSO etc.

【0059】

pyrimidine derivative (3) reacting under existing of phosphorous oxychloride and base next, you obtain chlorine compound (4).

With under or solventless diluting solvent existing pyrimidine derivative (3) vis-a-vis 1 mole phosphorous oxychloride from 1 mole excess quantity , base excess quantity you use reaction, from the catalyst amount , you advance profitably reflux of reaction system by 1 - 24 hours reacting under temperature which is done from room temperature .

As base , it can use pyridine , dimethylamino pyridine , triethylamine , N, N- dimethyl aniline etc.

【0060】

compound (4) which it acquires, compound (5) with reacting under existing of base in solvent , you obtain compound of General Formula (II) .

compound (4) vis-a-vis 1 mole , compound (5) from 1 mole 2 mole extent , base the excess quantity it uses reaction, from 1 mole , it advances profitably reflux of solvent by 1 - 24 hours reacting under temperature which is done from room temperature .

As base , it can use pyridine , dimethylamino pyridine , triethylamine , sodium alkoxide , sodium hydride , sodium hydroxide , potassium carbonate , DBU, DBN etc.

As solvent , you can list THF , diethyl ether or other ethers , benzene , toluene or other aromatic hydrocarbon , DMF , DMSO etc.

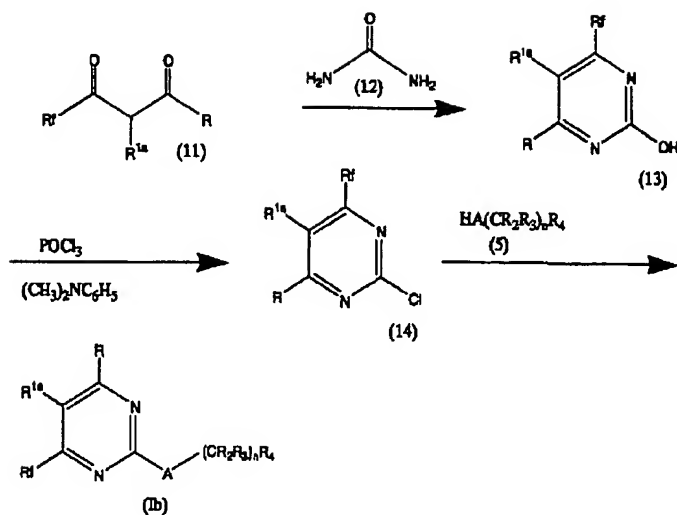
【0061】

By fact that it reacts in same way as description above the compound (1) and R of compound (2) and starting material compound which exchanges R<sub>f</sub> (1 a ) and making use of compound (2 a ) , compound of General Formula (Ia ) which exchanges R and R<sub>f</sub> compound (3 a ) , via compound (4 a ) can be acquired.

<reaction step scheme 2>

【0062】

[Chemical Formula 12]



【0063】

[式中 R、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sup>1a</sup>、R<sup>f</sup>、A 及び n は前記に同じ。]

β-ジケトン化合物(11)を尿素(12)と溶媒中反応させて、ピリミジン誘導体(13)を得る。

反応は、化合物(11)1 モルに対し、化合物(12)を1 モル程度~過剰量用い、室温から溶媒の還流する温度下に1~24 時間反応させることにより有利に進行する。

溶媒としては、メタノール、エタノールなどのアルコール、THF、ジエチルエーテルなどのエーテル類、DMF、DMSO 等が挙げられる。

【0064】

次にピリミジン誘導体(13)をオキシ塩化リンと塩基の存在下に反応させて、塩素化合物(14)を得る。

反応は、希釈溶媒存在下あるいは無溶媒でピリミジン誘導体(13)1 モルに対しオキシ塩化リンを1 モルから過剰量、塩基を触媒量から過剰量使用し、室温から反応系の還流する温度下に1~24 時間反応させることにより有利に進行する。

塩基としては、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミンなどが用いられる。

【0065】

得られた塩素化合物(14)と化合物(5)とを溶媒中塩基の存在下に反応させて、一般式(1b)の化合

【0063】

[As for R, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sup>1a</sup>, R<sup>f</sup>, A and n in Formula same to description above. ]

The β-diketone compound (11) urea (12) with in solvent reacting, you obtain pyrimidine derivative (13).

compound (12) 1 mole extent ~excess quantity it uses reaction, compound (11) vis-a-vis 1 mole, it advances profitably reflux of solvent by 1 - 24 hours reacting under temperature which is done from room temperature .

As solvent , you can list methanol , ethanol or other alcohol , THF , diethyl ether or other ethers , DMF , DMSO etc.

【0064】

pyrimidine derivative (13) reacting under existing of phosphorous oxychloride and base next, you obtain chlorine compound (14).

With under or solventless diluting solvent existing pyrimidine derivative (13) vis-a-vis 1 mole phosphorous oxychloride from 1 mole excess quantity , base excess quantity you use reaction, from the catalyst amount , you advance profitably reflux of reaction system by 1 - 24 hours reacting under temperature which is done from room temperature .

As base , it can use N, N- dimethyl aniline , pyridine , dimethylamino pyridine , triethylamine etc.

【0065】

chlorine compound which it acquires (14) with compound (5) reacting under existing of base in solvent , you obtain

物を得る。

反応は、塩素化合物(14)1 モルに対し、化合物(5)を1 モルから2 モル程度、塩基を1 モルから過剰量用い、室温から溶媒の還流する温度下に1~24 時間反応させることにより有利に進行する。

塩基としては、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、ナトリウムアルコキッド、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム、DBU、DBN などが用いられる。

溶媒としては、THF、ジエチルエーテルなどのエーテル類、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素、DMF、DMSO 等が挙げられる。

【0066】

なお、A が SO または SO<sub>2</sub> の化合物は、A が S である化合物(1)1 モルに対し、酢酸等の溶媒中、タングステン酸ナトリウム等の触媒の存在下に1 モル又は2 モル以上の過酸化水素を、室温~80 deg C で、30 分~5 時間反応させることにより容易に得ることができるが、製造方法はこれに限定されるものではない。

【0067】

また、本明細書において、防除される有害生物としては、農園芸害虫〔例えば、半翅目(ウンカ類、ヨコバイ類、アブラムシ類、コナジラミ類など)、鱗翅目(ヨトウムシ類、コナガ、ハマキムシ類、メイガ類、シンクイムシ類、モンシロチョウなど)、鞘翅目(ゴミムシダマシ類、ゾウムシ類、ハムシ類、コガネムシ類など)、ダニ目(ハダニ科のミカンハダニ、ナミハダニなど、フシダニ科のミカンサビダニなど)、衛生害虫(例えば、ハエ、カ、ゴキブリなど)、貯穀害虫(コクストモドキ類、マメゾウムシ類など)、土壌中のネコブセンチュウ、マツノザイセンチュウ、ネダニなどを挙げることができ、また、農園芸病原菌(例えば、コムギ赤さび病、大麦うどんこ病、キュウリうどんこ病、キュウリべと病、イネいもち病、トマト疫病、カンキツ黒点病、リンゴ黒星病、トマト灰色かび病など)を挙げることができる。

compound of General Formula (1b) .

chlorine compound (14) vis-a-vis 1 mole , compound (5) from 1 mole 2 mole extent , base the excess quantity it uses reaction, from 1 mole , it advances profitably reflux of solvent by 1 - 24 hours reacting under temperature which is done from room temperature .

As base , it can use pyridine , dimethylamino pyridine , triethylamine , sodium alkoxide , sodium hydride , sodium hydroxide , potassium carbonate , DBU, DBN etc.

As solvent , you can list THF , diethyl ether or other ethers , benzene , toluene or other aromatic hydrocarbon , DMF , DMSO etc.

【0066】

Furthermore, with room temperature ~80 deg C, can acquire 1 mole or hydrogen peroxide of 2 mole or more , easily in acetic acid or other solvent and under existing of sodium tungstate or other catalyst 30 minute -5 hours by reacting A as for compound of SO or the SO<sub>2</sub> , compound where A is S (1) vis-a-vis 1 mole , but, manufacturing method is not something which is limited in this.

【0067】

In addition, horticulture insect pest { for example Hemiptera (Delphacidae (delphacid planthoppers) , Deltocephalidae (leafhoppers) , Aphididae (aphids) , such as Aleyrodidae (whiteflies) , Lepidoptera (armyworms , Plutella xylostella (Linnaeus) (diamondback moth, cabbage moth) , such as Tortricidae , Pyralidae , Carposinidae , Pieris rapae crucivora Boisduval (common white, common cabbage worm) , Coleoptera (Tenebrionidae (darkling beetles) , Curculionidae (weevils) , Chrysomelidae (leaf beetles) , such as Scarabaeidae , Acarina (mites and ticks) (Panonychus citri of Tetranychidae (spider mites) [McGregor] (citrus red mite) , such as Aculops pelekassi [Keifer] (pink citrus rust mite) of Eriophyidae (eriphyid mites) such as Tetranychus urticae) , hygienically harmful insect (for example fly , [ka] , such as cockroach) , stored grain insect ( [kokusutomodoki] , such as Bruchidae (seed beetle) , Meloidogyne sp. in soil (root-knot nematode) , Bursaphelenchus xylophilus (Steiner et Buhner) Nickle (pine wood nematode) , it can list Rhizoglyphus robini Claparede (bulb mite) etc as harmful organism which is prevented in this specification , in addition, horticulture pathogen (for example wheat red rust , barley powdery mildew , cucumber powdery mildew , cucumber downy mildew , rice blast , tomato Phytophthora rot , Citrus spp., Poncirus spp., fortunella spp. (citrus) melanose , apple scab (Venturia inaequalis [Cooke] Winter) , such as tomato gray mold of fruit ) it can list.

【0068】

本発明化合物及び有害生物防除剤は、人、家畜等に対して無害であり、魚毒性も低いので安全性に優れ、残留毒性の問題も無い。

【0069】

本発明の有害生物防除剤は、前記一般式(I)の化合物およびその塩を有効成分として含有している。

本発明の前記化合物を有害生物防除剤として用いる場合には、担体もしくは希釈剤、添加剤及び補助剤等と公知の手法で混合して、通常農薬として用いられる製剤形態、例えば粉剤、粒剤、水和剤、乳剤、水溶剤、フロアブル剤等の調製して使用される。

また他の農薬、例えば殺虫剤または殺菌剤、殺ダニ剤、植物成長調節剤等、肥料及び土壌改良材等と混合又は併用して使用することができる。

特に他の有害生物防除剤と混合使用することにより使用量を減少させ、また省力化をもたらすのみならず、両薬剤の共力作用による有害生物防除スペクトラムの拡大及び相乗作用による一層高い効果も期待できる。

【0070】

製剤に際して用いられる担体もしくは希釈剤としては、例えばカオリナイト群、モンモリロナイト群、あるいはボリゴロスカイト群で代表されるクレー群、詳しくはパイロフィライト、アタパルジャイト、セピオライト、カオリナイト、ベントナイト、バーミキュライト、雲母、タルク等；石膏、炭酸カルシウム、ドロマイト、ケイソウ土、マグネシウム石灰、リン灰石、ゼオライト、無水珪酸、合成珪酸カルシウム等のその他無機物質；大豆粉、タバコ粉、クルミ粉、小麦粉、木粉、澱粉、結晶セルロース等の植物性有機物質；クマロン樹脂、石油樹脂、アルキッド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリアルキレングリコール、ケトン樹脂、エステルガム、コーバルガム、ダンマルガム等の合成又は天然の高分子化合物；カルナウバロウ、蜜蝋等のワックス類あるいは尿素等が例示できる。

【0071】

適当な液体担体としては、例えばケロシン、鉱油、スピンドル油、ホワイトオイル等のパラフィン系またはナフテン系の炭化水素；キシレン、エチルベンゼン、クメン、メチルナフタリン等の芳香族炭化水素；トリクロロエチレン、モノクロロベンゼン、オルトクロロトルエン等の塩素化炭化水

【0068】

Because the compound of this invention and pest control agent being harmless vis-a-vis person and livestock etc, fish toxicity are low, it is superior in safety, there is not either a problem of remains toxicity.

【0069】

pest control agent of this invention contains compound and its salt of the aforementioned General Formula (I) as active ingredient.

When aforementioned compound of this invention it uses, as pest control agent the carrier or diluent, additive and auxiliary agent etc and mixing with technique of the public knowledge, formulation type, for example powder, granule, wettable, emulsion, water soluble, flowable or other which is used usually as pesticide manufacturing, it is used.

In addition, fertilizer and soil conditioner etc such as other pesticide, for example insecticide or microbicide, miticide, plant growth regulator and mixing or jointly using, or you can use.

Especially, decreasing use dose other pest control agent and by mixed use doing, in addition it brings labor reduction, furthermore, with cooperative effect of both pesticides furthermore you can expect also high effect with enlargement and synergistic action of pest control spectrum.

【0070】

clay group which is represented with for example kaolinite group, montmorillonite group or [porigosukaito] group as carrier or diluent which are used in case of formulation, details pyrophyllite (DANA 71.2.1.1), attapulgite, sepiolite, kaolinite, bentonite (DANA 71.3.1a.1-2), vermiculite (DANA 71.2.2d.3), gypsum, calcium carbonate, dolomite, diatomaceous earth, magnesium lime, apatite, zeolite, anhydrous silicic acid, synthetic calcium silicate or other such as mica, talc in addition can illustrate polymeric compound; carnauba wax, beeswax or other waxes or urea etc of inorganic substance; soybean meal, tobacco meal, walnut flour, wheat flour, wood flour, starch, crystalline cellulose or other vegetable organic matter; cumarone resin, petroleum resin, alkyd resin, polyvinyl chloride, polyalkylene glycol, ketone resin, ester gum, gum copal, gum dammar or other synthetic or natural.

【0071】

As suitable liquid carrier, you can list hydrocarbon; xylene, ethyl benzene, cumene, methyl naphthalene or other aromatic hydrocarbon; trichloroethylene, monochloro benzene, ortho chlorotoluene or other chlorinated hydrocarbon; dioxane, tetrahydrofuran or other ethers; acetone, methylethyl ketone, diisobutyl ketone,

素;ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類;アセトン、メチルエチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン、アセトフェノン、イソホロン等のケトン類;酢酸エチル、酢酸アミル、エチレングリコールアセテート、ジエチレングリコールアセテート、マレイン酸ジブチル、コハク酸ジエチル等のエステル類;メタノール、n-ヘキサノール、エチレングリコール、ジエチレングリコール、シクロヘキサノール、ベンジルアルコール等のアルコール類;エチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールブチルエーテル等のエーテルアルコール類;ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒あるいは水等があげられる。

[0072]

その他に本発明の化合物ないし有効成分の乳化、分散、湿潤、展着、拡張、結合、崩壊性調節、有効成分安定化、流動性改良、防錆、凍結防止等の目的で界面活性剤その他の補助剤を使用することもできる。

[0073]

使用する界面活性剤の例としては、非イオン性、陰イオン性、陽イオン性及び両性イオン性の何れも使用しうるが、通常は非イオン性およびまたは陰イオン性のものが使用される。

適当な非イオン系界面活性剤としては、例えばラウリルアルコール、ステアリルアルコール、オレイルアルコール等の高級アルコールにエチレンオキシドを重合付加させた化合物;イソオクチルフェノール、ノニルフェノール等のアルキルフェノールにエチレンオキシドを重合付加させた化合物;ブチルナフトール、オクチルナフトール等のアルキルナフトールにエチレンオキシドを重合付加させた化合物;パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸等の高級脂肪酸にエチレンオキシドを重合付加させた化合物;ソルビタン等の多価アルコールの高級脂肪酸エステルおよびそれにエチレンオキシドを重合付加させた化合物、エチレンオキシドとプロピレンオキシドをブロック重合付加させた化合物等があげられる。

[0074]

適当な陰イオン性界面活性剤としては、例えば、ラウリル硫酸ナトリウム、オレイルアルコール硫酸エステルアミン塩等のアルキル硫酸エステル塩、スルホコハク酸ジオクチルエステルナトリウム、2-エチルヘキセンスルホン酸ナトリウム等のアルキルスルホン酸塩、イソプロピルナフタ

cyclohexanone, acetophenone, isophorone or other ketones; ethylacetate, amyl acetate, ethyleneglycol acetate, diethylene glycol acetate, dibutyl maleate, diethyl succinate or other esters; methanol, n- hexanol, ethyleneglycol, diethylene glycol, cyclohexanol, benzyl alcohol or other alcohols; ethyleneglycol ethyl ether, diethylene glycol ethyl ether, diethylene glycol butyl ether or other ether alcohols; dimethylformamide, dimethyl sulfoxide or other polar solvent or water etc of for example kerosine, mineral oil, spindle oil, white oil or other paraffin type or naphthene type.

[0072]

In addition with compound of this invention or emulsification, dispersion, wetting, adhesion, spreading, connection and breakdown regulation, active ingredient stabilization, flow improvement, rust prevention, antifreezing or other objective of active ingredient boundary it can also use surfactant other auxiliary agent.

[0073]

It can use in each case of nonionic, anionic, cationic and zwitterionic, as example of the boundary surfactant which you use, but those of nonionic and/or anionic are usually used.

As suitable nonionic surfactant, in for example lauryl alcohol, stearyl alcohol, oleyl alcohol or other higher alcohol in compound; isooctyl phenol, nonylphenol or other alkylphenol which you polymerize add the ethylene oxide in compound; butyl naphthol, octyl naphthol or other alkyl naphthol which you polymerize add ethylene oxide you polymerize add higher fatty acid ester of compound; sorbitan or other polyhydric alcohol which you polymerize add ethylene oxide and the compound, ethylene oxide which ethylene oxide and compound etc which block you polymerize add propylene oxide can list to compound; palmitic acid, stearic acid, oleic acid or other higher aliphatic acid which you polymerize add ethylene oxide to that.

[0074]

As suitable anionic surfactant, you can list for example sodium lauryl sulfate, oleyl alcohol sulfate ester amine salt or other alkyl sulfuric acid ester salt, dioctyl sulfosuccinate ester sodium, 2-ethyl hexene sodium sulfonate or other alkyl sulfonate, sodium isopropyl naphthalene sulfonate, sodium methylene bis naphthalene sulfonate, sodium lignin

レンスルホン酸ナトリウム、メチレンビスナフタレンスルホン酸ナトリウム、リグニンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム等のアリアルスルホン酸塩等があげられる。

## 【0075】

さらに本発明の有害生物防除剤には、製剤の性状を改善し有害生物防除効果を高める目的で、カゼイン、ゼラチン、アルブミン、ニカワ、アルギン酸ソーダ、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ポリビニルアルコール等の高分子化合物や他の補助剤を併用することもできる。

## 【0076】

上記の担体及び種々の補助剤は製剤の剤型、適用場面等を考慮して、目的に応じてそれぞれ単独あるいは組み合わせて適宜使用される。

## 【0077】

このようにして得られた各種剤型における本発明化合物有効成分含有率は製剤型により種々変化するものであるが、通常 0.1~99 重量%が適当であり、好ましくは 1~80 重量%が最も適当である。

## 【0078】

水和剤の場合は、例えば有効成分化合物を通常 25~90%含有し、残部は固体担体、分散湿潤剤であって必要に応じて保護コロイド剤、消泡剤等が加えられる。

## 【0079】

粒剤の場合は、例えば有効成分化合物通常 1~35%含有し、残部は固体担体および界面活性剤等である。

有効成分化合物は固体担体と均一に混合されているか、あるいは固体担体の表面に均一に固着または吸着されており、粒径は約 0.2 乃至 1.5mm である。

## 【0080】

乳剤の場合は、例えば、有効成分化合物を通常 5~30%含有しており、これに約 5 乃至 20 重量%の乳化剤が含まれ、残部は液体担体であり、必要に応じて、展着剤および防錆剤等が加えられる。

## 【0081】

フロアブル剤の場合は、例えば有効成分化合物を通常 5~50 重量%含有しており、これに 3 乃至

sulfonate, sodium dodecyl benzene sulfonate or other aryl sulfonate etc.

## 【0075】

Furthermore, you improve properties of formulation in pest control agent of the this invention and with objective which raises pest control effect, you can also jointly use casein, gelatin, albumin, glue, sodium alginate, carboxymethyl cellulose, methylcellulose, hydroxyethyl cellulose, poly vinyl alcohol or other polymeric compound and other auxiliary agent.

## 【0076】

Above-mentioned carrier and various auxiliary agent is used drug form, application locale etc of formulation considering, respective alone or combining according to objective appropriately.

## 【0077】

the compound of this invention active ingredient content in various drug form which it acquires this way various is something which changes with formulation type, but usually 0.1 - 99 weight % being suitable, preferably 1~80 weight % is most suitable.

## 【0078】

In case of wettable, for example active ingredient compound is contained usually 25 - 90%, the remainder according to need protective colloid agent, foam inhibitor etc is added with solid carrier, dispersing and wetting agent.

## 【0079】

In case of granule, for example active ingredient compound usually 1 - 35% it contains, remainder is solid carrier and boundary surfactant etc.

active ingredient compound to be mixed to solid carrier and uniform, or to surface of solid carrier have become fixed or be adsorbed by uniform, particle diameter is approximately 0.2 to 1.5mm.

## 【0080】

In case of emulsion, usually 5 - 30% we contain for example active ingredient compound, emulsifier of approximately 5 to 20 weight % is included by this, remainder is added with liquid carrier, according to need, spreading agent and rust inhibitor etc.

## 【0081】

In case of flowable, usually 5 - 50 weight % we contain for example active ingredient compound, the dispersing and

至 10 重量%の分散湿潤剤が含まれ、残部は必要に応じて保護コロイド剤、防腐剤、消泡剤等が加えられる。

【0082】

本発明の化合物は、前記一般式(I)の化合物のまま、あるいは上述した様な任意の製剤形態で除草剤として使用することができる。

【0083】

本発明の化合物および有害生物防除剤は、各種の病原菌及び害虫に施用できる。

その施用量は一般式(I)で表わされる化合物量(有効成分量)としてヘクタール当たり、1~1000g程度、好ましくは 25~500g 程度である。

典型的な施用濃度は、0.1~1000ppm、好ましくは 0.1~500ppm である。

またその施用量は、目的とする病原菌ないし害虫の種類、施用場所、施用時期、天候等によって適宜に選択変更できる。

【0084】

次に本発明を実施例を用いて具体的に説明するが、本発明はこれに限定されるものではない。

【0085】

#### 【実施例】

##### 実施例 1

(1) 4-(3,5-ジフルオロベンジルスルフィニル)-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン(No.1-21)の合成

4-クロロ-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 983mg(5.0mmol)を DMF10ml に溶解し、3,5-ジフルオロベンジルメルカプタン 801mg(5.0mmol)と炭酸カリウム 691mg(5.0mmol)を加え、約 10 時間室温で攪拌した。

反応液をろ過し、ろ液に酢酸エチル 50ml と水 50ml を加え抽出後、分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-300、酢酸エチル:ヘキサン=1:20 溶出)で精製することによって 4-(3,5-ジフルオロベンジルチオ)-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 1.54g(96%)を得た。

得られた 4-(3,5-ジフルオロベンジルチオ)-2-メチル

wetting agent of 3 to 10weight % is included by this, remainder is added according to need protective colloid agent, antiseptic, foam inhibitor etc.

【0082】

Way, or description above which is a compound of aforementioned General Formula (I), you can use compound of this invention, with formulation type of the kind of option which is done as herbicide.

【0083】

To various pathogen and insect pest application is possible compound and the pest control agent of this invention.

application amount is per hectare, 1~1000g extent, preferably 25~500g extent compound amount which is displayed with General Formula (I) (amount of active ingredient) as.

typical application concentration is 0.1 - 1000 ppm, preferably 0.1 ~500ppm.

In addition application amount, appropriately it can select can modify with such as types, application site, application time, climate of pathogen or insect pest which is made objective.

【0084】

Next this invention is explained concretely making use of Working Example, but this invention is not something which is limited in this.

【0085】

#### 【Working Example(s)】

##### Working Example 1

(1) 4 - (3 and 5 -difluoro benzyl sulfinyl) - 2 -methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine synthesis of (No.1- 21)

4 -chloro -2- methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 983mg it melted (5.0 mmol) in DMF 10ml, it agitated with approximately 10 hours room temperature 3 and 5 -difluoro benzyl mercaptan 801mg (5.0 mmol) with including potassium carbonate 691mg (5.0 mmol).

It filtered in filtrate after extracting, separating it did organic layer with sodium sulfate and including ethylacetate 50ml, and water 50 ml, reaction mixture, dried vacuum concentration did.

4 - (3 and 5 -difluoro benzyl thio) - 2 -methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 1.54g (96%) was acquired by fact that residue which it acquires is refined with silica gel column chromatography (Wako Gel C-300, ethylacetate :hexane =1:20 liquation).

4 it acquires - (3 and 5 -difluoro benzyl thio) - 2 -methyl



ル -6-トリフルオロメチルピリミジン 641mg(2.0mmol)を酢酸 10ml に溶解し、タングステン酸ナトリウム 10 水和物 66mg(0.20mmol)を加え 50 deg C に加温し、35%過酸化水素水 194mg(2.0mmol)を滴下し 30 分間攪拌した。

室温に戻し、反応液に酢酸エチル 50ml と水 50ml を加え抽出後、分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮した。

得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-300、酢酸エチル:ヘキサン=1:5 溶出)で精製することによって 4-(3,5-ジフルオロベンジルスルホニル)-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 520mg(77%)を得た。

(2) 4-(3,5-ジフルオロベンジルスルホニル)-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン(No.8-21)の合成

4-(3,5-ジフルオロベンジルチオ)-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 641mg(2.0mmol)を酢酸 10ml に溶解し、タングステン酸ナトリウム 10 水和物 132mg(0.40mmol)を加え 50 deg C に加温し、35%過酸化水素水 388mg(4.0mmol)を滴下し 1 時間攪拌した。

室温に戻し、反応液に酢酸エチル 50ml と水 50ml を加え抽出後、分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮した。

得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-300、酢酸エチル:ヘキサン=1:5 溶出)で精製することによって 4-(3,5-ジフルオロベンジルスルホニル)-2-メチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 590mg(84%)を得た。

(3) 2,5-ジメチル-4-(3-フェニルプロピルアミノ)-6-トリフルオロメチルピリミジン(No.19-8)の合成

4-クロロ-2,5-ジメチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 210mg(1.0mmol)を THF 10ml に溶解し、トリエチルアミン 101mg(1.0mmol)と 3-フェニルプロピルアミン 135mg(1.0mmol)を加え、約 10 時間室温で攪拌した。

反応液に酢酸エチル 30ml と水 30ml を加え抽出後、分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮した。

得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-300、酢酸エチル:ヘキサン=1:7 溶出)で精製することによって 2,5-ジメチル-4-(3-フェニルプロピルアミノ)-6-トリフルオロメチルピリミジン 300mg(97%)を得た。

-6-trifluoromethyl pyrimidine 641mg it melted (2.0 mmol ) in acetic acid 10ml , it heated to 50 deg C including sodium tungstate decahydrate 66mg (0.20 mmol ) , dripped 35% hydrogen peroxide water 194mg (2.0 mmol ) and 30 minute agitated.

You reset in reaction mixture after extracting, separating you did organic layer with sodium sulfate and including ethylacetate 50ml , and water 50 ml , to room temperature , dried vacuum concentration did.

4 - (3 and 5 -difluoro benzyl sulfanyl ) - 2 -methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 520mg (77%) was acquired by fact that residue which it acquires is refined with silica gel column chromatography (Wako Gel C-300, ethylacetate :hexane =1:5 liquation).

(2) 4 - (3 and 5 -difluoro benzyl sulfanyl ) - 2 -methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine synthesis of (No.8-21 )

4 - (3 and 5 -difluoro benzyl thio ) - 2 -methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 641mg it melted (2.0 mmol ) in acetic acid 10ml , it heated to 50 deg C including sodium tungstate decahydrate 132mg (0.40 mmol ) , dripped 35% hydrogen peroxide water 388mg (4.0 mmol ) and 1 hour agitated.

You reset in reaction mixture after extracting, separating you did organic layer with sodium sulfate and including ethylacetate 50ml , and water 50 ml , to room temperature , dried vacuum concentration did.

4 - (3 and 5 -difluoro benzyl sulfanyl ) - 2 -methyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 590mg (84%) was acquired by fact that residue which it acquires is refined with silica gel column chromatography (Wako Gel C-300, ethylacetate :hexane =1:5 liquation).

(3) 2 and 5 -dimethyl -4- (3 -phenyl propyl amino ) - 6 -trifluoromethyl pyrimidine synthesis of (No.19-8 )

4 -chloro -2, 5-dimethyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 210mg it melted (1.0 mmol ) in THF 10ml , it agitated with approximately 10 hours room temperature triethylamine 101mg (1.0 mmol ) with 3 -phenyl propyl amine 135mg including (1.0 mmol ).

In reaction mixture after extracting, separating it did organic layer with the sodium sulfate and including ethylacetate 30ml , and water 30 ml , dried the vacuum concentration did.

2 and 5 -dimethyl -4- (3 -phenyl propyl amino ) - 6 -trifluoromethyl pyrimidine 300mg (97%) was acquired by fact that the residue which it acquires is refined with silica gel column chromatography (Wako Gel C-300, ethylacetate :hexane =1:7 liquation).

(4) 4-(n-デシルアミノ)-2,5-ジメチル-6-トリフルオロメチルピリミジン(No.17-17)の合成

4-クロロ-2,5-ジメチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 210mg(1.0mmol)を THF10ml に溶解し、トリエチルアミン 101mg(1.0mmol)と n-デシルアミン 157mg(1.0mmol)を加え、約 10 時間室温で撹拌した。

反応液に酢酸エチル 30ml と水 30ml を加え抽出後、分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ワコーゲル C-300、酢酸エチル:ヘキサン=1:7 溶出)で精製することによって4-(n-デシルアミノ)-2,5-ジメチル-6-トリフルオロメチルピリミジン 280mg(88%)を得た。

【0086】

上記実施例 1(1)~(4)と同様にして、第 1 表~第 21 表の化合物を合成した。

【0087】

尚、表中の化合物は NMR、IR、元素分析、融点等の物性値によって構造を確認した。

【0088】

【表 1】

(4) 4 - (n- decyl amino ) - 2 and 5 -dimethyl -6-trifluoromethyl pyrimidine synthesis of (No.17-17 )

4 -chloro -2, 5-dimethyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 210mg it melted (1.0 mmol ) in THF 10ml , it agitated with approximately 10 hours room temperature triethylamine 101mg (1.0 mmol ) with including n- decyl amine 157mg (1.0 mmol ) .

In reaction mixture after extracting, separating it did organic layer with the sodium sulfate and including ethylacetate 30ml , and water 30 ml , dried the vacuum concentration did.

4 - (n- decyl amino ) - 2 and 5 -dimethyl -6-trifluoromethyl pyrimidine 280mg (88%) was acquired by fact that residue which it acquires is refined with silica gel column chromatography (Wako Gel C-300, ethylacetate :hexane =1:7 liquation).

[0086]

Above-mentioned Working Example 1 (1) - (4) with to similar, compound of the Table 1 ~Table 21 was synthesized.

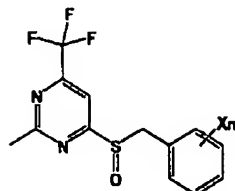
[0087]

Furthermore compound of in the table verified structure with nmr , IR , elemental analysis , melting point or other property value .

[0088]

[Table 1]

第1表



No.	Xn	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
1-1	H	Oil	2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.02(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.39(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.83-7.25(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.65(1H,s,H).
1-2	4-Cl	82-83	2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.01(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.39(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.90(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.20(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.71(1H,s,H).
1-3	2-CH <sub>3</sub>	102-103	2.33(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.83(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.07(2H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.50(2H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.82-7.18(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.87(1H,s,H).
1-4	3-CH <sub>3</sub>	57-60	2.27(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.89(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.00(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.39(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.72-6.85(2H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.00-7.19(2H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.72(1H,s,H).
1-5	3-Cl	66-67	
1-6	4-F	Oil	
1-7	4-Br	117-118	2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.99(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.37(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.85(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.36(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.72(1H,s,H).
1-8	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Oil	
1-9	3,4-Cl <sub>2</sub>	105-106	
1-10	2-F	Oil	2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.16(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.44(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.72-7.35(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.68(1H,s,H).
1-11	3-F	72-75	2.89(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.03(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.41(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.87-7.28(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.74(1H,s,H).
1-12	4-OCH <sub>3</sub>	80-83	2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.72(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.99(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.37(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.70(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 6.90(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.67(1H,s,H).
1-13	4-CF <sub>3</sub>	101-102	2.90(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.10(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.49(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.13(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.51(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.70(1H,s,H).

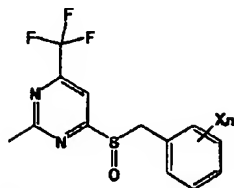
[0089]

[0089]

[表 2]

[Table 2]

第1表 (つづき)



No.	Xn	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
1-14	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	160-161	2.27(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.34(6H,s,(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.38(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.88(2H,s,C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 8.12(1H,s,H).
1-15	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	106-107	2.89(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.07(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.45(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.86-7.50(9H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.72(1H,s,H).
1-16	3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Oil	2.78(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.88(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.37(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.46-7.30(9H,m,C <sub>10</sub> H <sub>7</sub> O), 7.73(1H,s,H).
1-17	2-Cl	91-92	2.83(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.25(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.59(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.23(4H,s,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.79(1H,s,H).
1-18	4-CH <sub>3</sub>	100-101	2.27(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.98(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.36(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.81(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.01(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.64(1H,s,H).
1-19	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	90-91	2.26(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.29(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.05(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.48(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.80-6.89(3H,m,C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 7.87(1H,s,H).
1-20	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	100-101	2.15(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.18(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.94(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.33(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.62-7.08(3H,m,C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 7.88(1H,s,H).
1-21	3,5-F <sub>2</sub>	82-83	2.89(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.01(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.39(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.54-6.90(3H,m,C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 7.81(1H,s,H).
1-22	2-CF <sub>3</sub>	105-106	2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.10(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.71(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.40-7.65(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 8.01(1H,s,H).
1-23	3-CF <sub>3</sub>	Oil	2.89(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.11(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.47(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.10-7.57(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 7.65(1H,s,H).

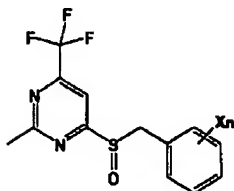
【0090】

【0090】

【表 3】

【Table 3】

第1表(つづき)



No.	Xn	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
1-24	2-OCH <sub>3</sub>	90-91	2.82(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.52(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.20(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.38(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 5.62-7.40(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.70(1H,s,H).
1-25	3-OCH <sub>3</sub>	77-78	2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.71(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.00(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.38(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 5.48-7.25(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.72(1H,s,H).
1-26	4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Oil	1.16(3H,t,CH <sub>3</sub> ), 2.57(2H,q,CH <sub>2</sub> ), 2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.89(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.37(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.82(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.04(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.63(1H,s,H).
1-27	2-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	104-105	1.22(3H,t,CH <sub>3</sub> ), 2.70(2H,q,CH <sub>2</sub> ), 2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.09(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.54(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.00-7.28(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.91(1H,s,H).
1-28	4-OOF <sub>2</sub>	oil	2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.03(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.41(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.02(4H,s,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.67(1H,s,H).

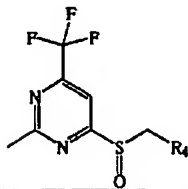
[0091]

[0091]

[表 4]

[Table 4]

第2表



No.	R4	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
2-1		147-148	2.82(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.50(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.88(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 7.28-7.48(4H,m,C <sub>10</sub> H <sub>7</sub> ), 7.60-7.80(3H,m,C <sub>10</sub> H <sub>7</sub> ), 7.70(1H,s,H).
2-2		109-110	2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.18(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 4.58(1H,d,CH <sub>2</sub> ), 6.88-7.80(8H,m,C <sub>10</sub> H <sub>7</sub> ).

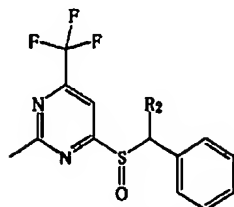
[0092]

[0092]

[表 5]

[Table 5]

第3表



No.	R <sub>2</sub>	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
3-1	CH <sub>3</sub>	oil	1.51(3H,d,CH <sub>3</sub> ), 2.83(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.30(1H,q,CH), 7.26(5H,s,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.80(1H,s,H).
3-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	oil	0.82(3H,t,CH <sub>3</sub> ), 1.83-2.28(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 2.80(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.88-4.14(1H,m,CH), 7.00-7.32(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.67(1H,s,H).

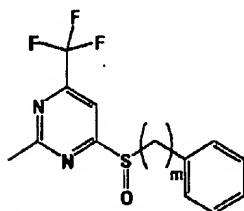
【0093】

【0093】

【表 6】

【Table 6】

第4表



No.	m	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
4-1	2	oil	2.80(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.00-3.50(4H,m,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 7.14(5H,s,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 8.03(1H,s,H).
4-2	3	oil	1.80-2.40(2H,m,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.80-3.24(4H,m,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.79(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 7.11-7.19(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 8.08(1H,s,H).

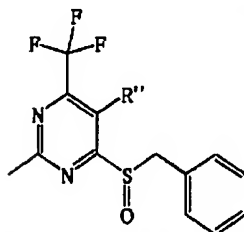
【0094】

【0094】

【表 7】

【Table 7】

第5表



No.	R''	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
5-1	CH <sub>3</sub>	oil	2.05(3H,br,CH <sub>3</sub> ), 2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.33(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.86-7.35(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).

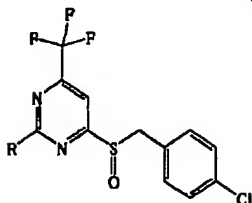
[0095]

[0095]

【表 8】

[Table 8]

第8表



No.	R	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
6-1	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	96-97	1.39(6H,d,(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ), 3.10-3.57(1H,m,CH), 4.01(2H,d,C-H <sub>2</sub> ), 4.37(2H,d,C-H <sub>2</sub> ), 6.87(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.16(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.68(1H,s,H).

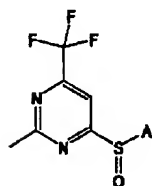
[0096]

[0096]

【表 9】

[Table 9]

第7表



No.	A	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
7-1	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	oil	2.04-2.43(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.17-3.50(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 4.04(2H,t,CH <sub>2</sub> ), 6.66-7.37(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 8.13(1H,s,H).
7-2	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	oil	1.28(9H,s,C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.84(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 8.08(1H,s,H).
7-3	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	oil	0.89(3H,br,CH <sub>3</sub> ), 1.28(12H,br,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.84(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.89(2H,br,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 8.11(1H,s,H).

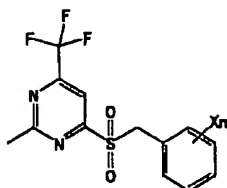
[0097]

[0097]

【表 10】

[Table 10]

第8表



No.	Xn	<sup>1</sup> H-NMR spectrum (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
8-1	H	2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.87(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.23(5H,s,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.81(1H,s,H).
8-2	4-Cl	
8-3	4-CH <sub>3</sub>	
8-4	2-Cl	
8-5	2-CH <sub>3</sub>	
8-6	3-CH <sub>3</sub>	
8-7	3-Cl	
8-8	4-F	
8-9	4-Br	
8-10	4-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	
8-11	3,4-Cl <sub>2</sub>	
8-12	2-F	2.86(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.68(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.93-7.50(4H,m, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.85(1H,s,H).
8-13	3-F	2.94(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.65(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.85-7.42(4H,m, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.85(1H,s,H).
8-14	4-OCH <sub>3</sub>	2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.73(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.80(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.75(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.11(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.80(1H,s,H).
8-15	4-OF <sub>2</sub>	2.98(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.76(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.38(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.81(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.90(1H,s,H).
8-16	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2.86(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.38(6H,s,(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ), 2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.80(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.86(2H,s,C <sub>6</sub> H <sub>2</sub> ), 7.89(1H,s,H).
8-17	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2.86(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.70(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.27-7.56(9H,m, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.85(1H,s,H).

【0098】

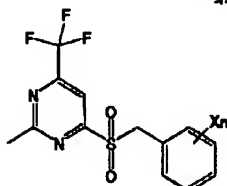
【0098】

【表 11】

【Table 11】



第8表(つづき)



No.	Xn	<sup>1</sup> H-NMR spectrum (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
8-18	3-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2.84(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.83(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.70-7.30(8H,m, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> O), 7.83(1H,s,H).
8-19	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2.28(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.38(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 2.97(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.69(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.88-7.08(3H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.85(1H,s,H).
8-20	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2.18(6H,s,(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.57(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.83-7.05(3H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.77(1H,s,H).
8-21	3,5-F <sub>2</sub>	2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.65(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.60-6.94(3H,m, C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ), 7.81(1H,s,H).
8-22	2-CF <sub>3</sub>	2.88(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.88(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.16-7.63(4H,m, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.90(1H,s,H).
8-23	3-CF <sub>3</sub>	2.85(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.74(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.44-7.54(4H,m, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.85(1H,s,H).
8-24	2-OCH <sub>3</sub>	2.83(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.51(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.71(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.60-7.30(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.73(1H,s,H).
8-25	3-OCH <sub>3</sub>	2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.73(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.63(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 6.65-7.20(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.83(1H,s,H).
8-26	4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1.17(3H,t,CH <sub>3</sub> ), 2.57(2H,q,CH <sub>2</sub> ), 2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.61(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.07(4H,m,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.77(1H,s,H).
8-27	4-OCF <sub>3</sub>	2.84(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.88(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.09(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.30(2H,d,C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.86(1H,s,H).

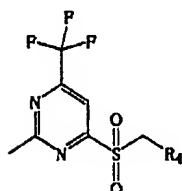
[0099]

[0099]

【表 12】

[Table 12]

第9表



No.	R4	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
9-1		2.89(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 5.12(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.17-8.02(8H,m, C <sub>10</sub> H <sub>7</sub> H).
9-2		2.95(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.82(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.18-7.80(8H,m, C <sub>10</sub> H <sub>7</sub> H).

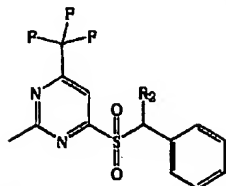
【0100】

【0100】

【表 13】

【Table 13】

第10表



No.	R2	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
10-1	CH <sub>3</sub>	1.82(3H,d,CH <sub>3</sub> ), 2.92(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.85(1H,q,CHCH <sub>3</sub> ), 7.20(5H,s,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.87(1H,s,H).
10-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0.94(3H,t,CH <sub>3</sub> ), 2.10-2.56(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 2.91(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.47-4.75(1H,m,CH), 7.19(5H,s,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.82(1H,s,H).

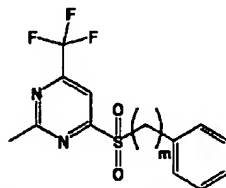
【0101】

【0101】

【表 14】

【Table 14】

第11表



No.	m	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
11-1	2	
11-2	3	1.93-2.36(2H,m,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.65-2.88(2H,m,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.86(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.28-3.53(2H,m,(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 7.05-7.20(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 8.01(1H,s,H).

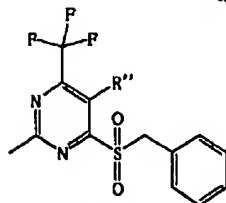
【0102】

【0102】

【表 15】

【Table 15】

第12表



No.	R''	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
12-1	CH <sub>3</sub>	2.63(3H,br,CH <sub>3</sub> ), 2.83(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.83(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.29-7.48(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.85(1H,s,H).

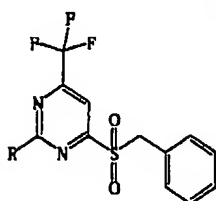
【0103】

【0103】

【表 16】

[Table 16]

第13表



No.	R	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
13-1	H		
13-2	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>		4.72(2H, s, CH <sub>2</sub> ), 7.20(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.45-7.56(3H, m, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.80(1H, s, H), 8.40-8.57(2H, m, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).

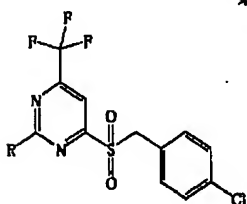
【0104】

[0104]

【表 17】

[Table 17]

第14表



No.	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
14-1	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1.45(6H, d, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ), 3.20-3.87(1H, m, CH), 4.87(2H, s, CH <sub>2</sub> ), 7.22(4H, s, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.87(1H, s, H).

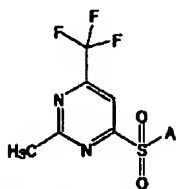
【0105】

[0105]

【表 18】

[Table 18]

第15表



No.	A	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ (ppm))
15-1			2.15-2.44(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 2.87(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.56-3.81(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 4.03(2H,t,CH <sub>2</sub> ), 6.65-7.22(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 8.04(1H,s,H)
15-2	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>		1.47(9H,s,O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ), 2.92(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 8.07 (1H,s,H).
15-3	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>		
15-4	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		
15-5			
15-6	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>		0.60-0.88(3H,m,CH <sub>3</sub> ), 1.28(12H,br, (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> ), 2.92(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.30-3.57 (2H, m, CH <sub>2</sub> ), 8.07(1H,s,H).
15-7	(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> CH <sub>3</sub>		
15-8	(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> CH <sub>3</sub>		
15-9	(CH <sub>2</sub> ) <sub>12</sub> CH <sub>3</sub>		
15-10			
15-11			
15-12			2.81(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 4.53(2H,s,CH <sub>2</sub> ), 5.02 (2H,s,CH <sub>2</sub> ), 7.00-7.33(5H,m,C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.92 (1H,s,H).
15-13			

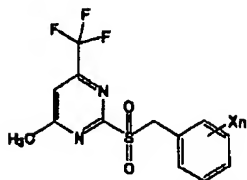
[0106]

[0106]

【表 19】

[Table 19]

第16表



No.	X <sub>n</sub>	Mp(°C)	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm))
16-1	H		2.72(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 4.78(2H, s, CH <sub>2</sub> ), 7.27(5H, br, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 7.57(1H, s, H).
16-2	4-Cl		2.77(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 4.78(2H, s, CH <sub>2</sub> ), 7.28(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.60(1H, s, H).
16-3	2-Cl		
16-4	4-CH <sub>3</sub>		

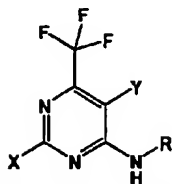
【0107】


【表 20】

[0107]

[Table 20]

第17表



No.	R	R'	(CR <sub>2</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>n</sub> R <sub>4</sub>	物性値
17-1	CH <sub>3</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.26(6H, d, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.52(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 3.70-4.25(1H, m, CH), 5.00(1H, br, NH), 6.37(1H, s, H). mp: 90-91°C
17-2	CH <sub>3</sub>	H	H <sub>2</sub> O- 	mp: 55-56°C
17-3	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	
17-4	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
17-5	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	
17-6	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	
17-7	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> CH <sub>3</sub>	
17-8	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	
17-9	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 0.88-0.98(3H, m, CH <sub>3</sub> ), 1.30(14H, br, (CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> ), 2.52(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 3.15-3.48(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 5.20(1H, br, NH), 6.38(1H, s, H).
17-10	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> CH <sub>3</sub>	
17-11	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> CH <sub>3</sub>	mp: 48-49°C
17-12	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>17</sub> CH <sub>3</sub>	mp: 55-56°C
17-13	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 0.85-0.98(3H, m, CH <sub>3</sub> ), 1.27(14H, br, (CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> ), 3.14-3.60(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 5.10(1H, br, NH), 6.40(1H, s, H), 7.28-7.45(3H, m, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 8.22-8.45(2H, m, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).
17-14	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	

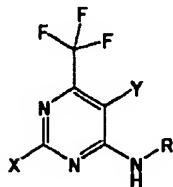
[0108]

【表 21】

[0108]

[Table 21]

第17表(つづき)



No.	R	R'	(CR <sub>2</sub> RS)nR <sub>4</sub>	物性値
17-16	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> CH <sub>3</sub>	
17-16	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> CH <sub>3</sub>	
17-17	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> CH <sub>3</sub>	
17-18	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 0.88-1.00(3H,m,CH <sub>3</sub> ), 1.28(18H,br, (CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> ), 2.10(3H,br,CH <sub>3</sub> ), 2.52(3H,s, CH <sub>3</sub> ), 3.35-3.67(2H,m,CH <sub>2</sub> ), 4.75(1H,s, NH).
17-19	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> CH <sub>3</sub>	

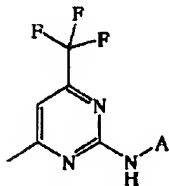
【0109】

[0109]

【表 22】

[Table 22]

第18表



No.	A	物性値
18-1	(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> CH <sub>3</sub>	
18-2	(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> CH <sub>3</sub>	
18-3	(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 0.88-1.00(3H,m,CH <sub>3</sub> ), 1.27(18H,br, (CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> ), 2.38(3H,s,CH <sub>3</sub> ), 3.23-3.58 (2H,m,CH <sub>2</sub> ), 5.20(1H,br,NH), 8.60(1H,s, H).

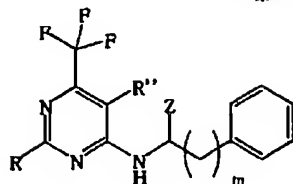
【0110】

[0110]

【表 23】

[Table 23]

第19表



No.	R	R''	Z	m	物性値
19-1	CH <sub>3</sub>	H	H	1	mp:83-84°C
19-2	OH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.25(3H, d, CH <sub>3</sub> ), 1.78-2.04(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 2.52(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 2.58-2.83(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 3.52-4.17(1H, br, CH), 4.81-5.21(1H, br, NH), 6.25(1H, s, H), 7.18(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).
19-3	CH <sub>3</sub>	H	H	3	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.52-1.77(4H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ), 2.48(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 2.50-2.78(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 3.15-3.48(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 5.18(1H, br, NH), 6.33(1H, s, H), 7.12(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).
19-4	CH <sub>3</sub>	H	H	2	mp:60-61°C
19-5	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	H	3	
19-6	H	H	H	3	mp:55-56°C
19-7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	3	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.55-1.78(4H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ), 2.08(3H, br, CH <sub>3</sub> ), 2.48-2.80(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.50(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 3.38-3.88(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 4.70(1H, br, NH), 7.15(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).
19-8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.79-2.10(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 1.94(3H, br, CH <sub>3</sub> ), 2.48-2.85(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 2.50(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 3.40-3.71(2H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ), 4.70(1H, br, NH), 7.18(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), mp:90-91°C
19-9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	

[0111]

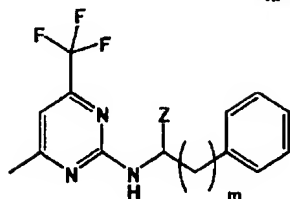
[表 24]

[0111]

[Table 24]



第20表



No.	Z	M	物性値
20-1	CH <sub>2</sub> (S)	0	
20-2	CH <sub>2</sub> (R)	0	
20-3	CH <sub>2</sub>	0	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.54(3H, d, CH <sub>3</sub> ), 2.33(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 5.05-5.31 (1H, m, CH), 5.48(1H, br, NH), 6.80(1H, s, H), 7.23(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).
20-4	H	3	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.52-1.77(4H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ), 2.36(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 2.49-2.78(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 3.26-3.60(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 5.20(1H, br, NH), 6.80(1H, s, H), 7.12(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).

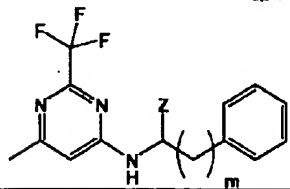
[0112]

[0112]

【表 25】

[Table 25]

第21表



No.	Z	M	物性値
21-1	CH <sub>2</sub> (R)	0	
21-2	CH <sub>2</sub> (S)	0	
21-3	H	3	<sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ (ppm)): 1.52-1.85(4H, m, (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ), 2.38(3H, s, CH <sub>3</sub> ), 2.51-2.78(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 3.10-3.44(2H, m, CH <sub>2</sub> ), 5.05(1H, br, NH), 6.13(1H, s, H), 7.13(5H, s, C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ).

[0113]

[0113]

生物試験例 1		
organism Test Example 1		
コムギ赤さび病菌	菌 (Puccinia)	recondita)
wheat red rust microbe	Puccinia microbe	recondita)

a.i.ppm に調製した水和剤をエアースプレーで 1 ポ

wetttable which is manufactured in a.i.ppm per 1 pot (4 flat

ット(4号平鉢、種子30粒分)あたり15ml散布した。

薬液の風乾後、孢子懸濁液を噴霧接種し、20 deg Cの温室に置き、処理約10日後、発病程度を評価した。

#### [0114]

完全に防除効果を示した化合物は、1-3、1-4、1-6、1-8、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-20、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、3-1、3-2、4-1、4-2、5-1、6-1、7-1、7-3、8-3、8-5、8-6、8-7、8-8、8-12、8-13、8-14、8-15、8-16、8-20、8-22、8-23、8-24、8-25、8-26、8-27、10-1、10-2、11-2、12-1、14-1、15-1、15-2、15-3、15-6、15-11、17-2、19-1、19-2、19-4、19-8、19-9、20-1、20-2、20-3であった。

pot, seed 30particle fraction) 15 ml scattering fabric was done with air brush.

After air dry of reagent solution, atomization inoculation it did condiospore suspension, placed in greenhouse of 20 deg C, after treatment approximately 10 days, the evaluation did disease extent.

#### [0114]

As for compound which shows protective effect completely, 1 - 3 and 1 - 4 and 1 - 6 and 1 - 8 and 1 - 10 and 1 - 11 and 1 - 12 and 1 - 13 and 1 - 14 and 1 - 20 and 1 - 22 and 1 - 23 and 1 - 24 and 1 - 25 and 1 - 26 and 1 - 27 and 1 - 28 and 3 - 1 and 3 - 2 and 4 - 1 and 4 - 2 and 5 - 1 and 6 - 1 and 7 - 1 and 7 - 3 and 8 - 3 and 8 - 5, 8 - 6 and 8 7 and 8 - 8 and 8 - 12 and 8 - 13 and 8 - 14 and 8 - 15, 8 - 16, 8 - 20 and 8 - 22 and 8 - 23 and 8 - 24 and 8 - 25 and 8 - 26 and 8 - 27 and 10 - 1 and 1 0 - 2 and 1 1 - 2 and 1 2 - 1 and 1 4 - 1 and 1 5 - 1 and 1 5 - 2 and 1 5 - 3 and 15 - 6 and 1 5 - 11 and 17 - 2 and 1 9 - 1 and 1 9 - 2 and 1 9 - 4 and 19 - 8 and 19 - 9 and 2 0 - 1 and 2 0 - 2 and 2 0 - 3 was.

生物試験例2					
organism Test Example 2					
リンゴ黒	黒星病菌	(Ventur	ia	inaequalis	)
Malus pumila Miller var. domestica Schneider (apple) black	scab microbe	Ventur	ia	inaequalis	)

製した水和剤をスプレーガン(圧力 1kg/cm<sup>2</sup>)で10ml/2 ポット散布した。

薬液の風乾後、調製した孢子懸濁液をスプレーガン(圧力 1kg/cm<sup>2</sup>)で散布し、15 deg Cの人工気象室内、暗黒条件下で4日間、明条件下で10日間管理し、処理 14 日後に発病状態を調査した。

#### [0115]

完全な防除効果を示した化合物は、1-1、1-2、1-3、1-5、1-6、1-7、1-9、1-12、1-14、1-15、1-16、1-20、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、2-1、3-1、4-1、4-2、7-2、7-3、8-2、8-3、8-5、8-6、8-7、8-8、8-9、8-10、8-11、8-14、8-16、8-17、8-18、8-20、8-22、8-23、8-26、8-27、10-2、11-1、11-2、14-1、15-1、15-2、15-4、15-6、15-7、15-10、15-12、19-8、19-9であった。

Make wettable which is done 10 ml /2pot scattering fabric was done with spray gun (pressure 1kg/cm<sup>2</sup>;SP&gt;2&lt;/SP&gt; ).

After air dry of reagent solution, scattering fabric it did condiospore suspension which is manufactured with spray gun (pressure 1kg/cm<sup>2</sup>;SP&gt;2&lt;/SP&gt; ), inside artificial climate room of 15 deg C and under darkness condition 10 day managed under 4 day, light condition, investigated the disease state after treatment 14 day.

#### [0115]

As for compound which shows full-length protective effect, 1 - 1 and 1 - 2 and 1 - 3 and 1 - 5 and 1 - 6 and 1 - 7 and 1 - 9 and 1 - 12 and 1 - 14 and 1 - 15 and 1 - 16 and 1 - 20 and 1 - 22 and 1 - 23 and 1 - 24 and 1 - 25 and 1 - 26 and 1 - 27 and 1 - 28 and 2 - 1 and 3 - 1 and 4 - 1 and 4 - 2 and 7 - 2 and 7 - 3 and 8 - 2 and 8 - 3 and 8 - 5, 8 - 6 8 - 7 and 8 - 8 and 8 - 9 and 8 - 10 and 8 - 11 and 8 - 14, 8 - 16, 8 - 17 and 8 - 18 and 8 - 20 and 8 - 22 and 8 - 23 and 8 - 26 and 8 - 27 and 10 - 2 and 1 1 - 1 and 1 1 - 2 and 1 4 - 1 and 1 5 - 1 and 1 5 - 2 and 1 5 - 4 and 15 - 6 and 1 5 - 7 and 1 5 - 10 and 15 - 12 and 19 - 8, 19 - 9 was.

生物試験例3				
organism Test Example 3				
トマト灰色カビ病菌	(Botrytis		inerea	)
tomato gray mold (Botrytis cinerea Persoon ) microbe	Botrytis		inerea	)

(鉢植)に 500a.i.ppm に調製した水和剤をエアースプレーで 2 鉢あたり 5ml 散布した。

wettable which in (pot planting) is manufactured in 500 a.i.ppm per 2 pot 5 ml scattering fabric was done with air brush .

薬液の風乾後、PDA 培地で培養した孢子懸濁液をエアースプレーで噴霧接種し、恒温恒湿槽(20 deg C)に置き高温に保った。

After air dry of reagent solution , atomization inoculation it did condiospore suspension which wascultured with PDAculture medium with air brush , placed in constant temperature, constant humidity bath (20 deg C ) andmaintained at high temperature .

接種 7 日後に発病程度を評価したところ、完全な防除効果を示した化合物は、8-1、8-5、8-8 であった。

After inoculation 7 day when evaluation it does disease extent , compound whichshows full-length protective effect was, 8 - 1 and 8 - 5, 8 - 8.

生物試験例4				
organism Test Example 4				
トマト疫病菌	(Phytophthora		infestans	)
tomato Phytophthora rot microbe	Phytophthora		infestans	)

(殺菌土壌)に播種し、1.0~2.0 葉期の幼苗を栽培した。

seeding it did in (sterilization soil ) , cultivation did sprout of 1.0 - 2.0 leaf stage .

500a.i.ppm に調製した水和剤をエアースプレーで 1 ポットあたり 15ml 散布した。

wettable which is manufactured in 500 a.i.ppm 1 per pot 15ml scattering fabric was done with air brush .

薬液の風乾後、遊走子懸濁液をエアースプレーで噴霧接種し、恒温恒湿槽(20 deg C)に置き高温に保った。

After air dry of reagent solution , atomization inoculation it did zoosporangium suspension with the air brush , placed in constant temperature, constant humidity bath (20 deg C ) and maintained at high humidity .

接種 7 日後に各葉の発病程度を評価した。

disease extent of each leaf evaluation was done after inoculation 7 day.

完全な防除効果を示した化合物は、1-3、8-1 であった。

compound which shows full-length protective effect was, 1 - 3, 8 - 1.

生物試験例5					
organism Test Example 5					
イネいもち病菌	(Pyr	icular	ia	oryzae	)

rice blast fungi	Pyr	icular	ia	oryzae	)
に調製した水和剤をエアブラシで1ポット(4号平鉢、種子40粒分)あたり15ml散布した。	wetable which is manufactured per 1 pot (4 flat pot, seed 40particle fraction) 15 ml scattering fabric was done with air brush.				
薬液の風乾後、オートミール培地で培養した孢子懸濁液をスプレーガンで噴霧接種した。	After air dry of reagent solution, conidiospore suspension which was cultured with the oatmeal culture medium atomization inoculation was done with spray gun.				
処理後、薬剤無処理区において典型的な菱形病斑が形成された後(接種10~14日後)、いもち病の発病程度を評価した。	After treating, after typical diamond shape diseased spot was formed in chemical untreated plot (After inoculation 10~14 day), disease extent of rice blast evaluation was done.				
【0116】	[0116]				
完全な防除効果を示した化合物は、1-17、1-18、1-19、1-21、8-4、8-19、8-21、15-13であった。	compound which shows full-length protective effect was, 1 - 17 and 1 - 18 and 1 - 19 and 1 - 21 and 8 - 4 and 8 - 19 and 8 - 21, 15 - 13.				

生物試験例6					
organism Test Example 6					
カンキツ黒点病菌	(Diaporthe	itr			)
Citrus spp., Poncirus spp., fortunella spp. (citrus) melanose microbe	Diaporthe	itr			)

(圧力 2.0kg/cm<sup>2</sup>)で1ポットあたり15ml散布した。

1 per pot 15ml scattering fabric it did with (pressure 2.0kg/cm<sup>2</sup>;SP&gt;2&lt;/SP&gt; ).

薬液の風乾後、調製した分生子の懸濁液をスプレーガン(圧力 2.0kg/cm<sup>2</sup>)で散布し、処理後14日に発病程度を調査した。

After air dry of reagent solution, suspension of conidia which ismanufactured scattering fabric was done with spray gun (pressure 2.0kg/cm<sup>2</sup>;SP&gt;2&lt;/SP&gt; ), aftertreating disease extent was investigated on 14th.

完全な防除効果を示した化合物は、8-2、8-3、15-6、15-12であった。

compound which shows full-length protective effect was, 8 - 2 and 8 - 3 and 15 - 6 and 15 - 12.

生物試験例7		
organism Test Example 7		
ナミハダニ(Tetranychus	urticae	)
Tetranychus Tetranychus urticae	urticae	)

ダニ雌成虫を5個体接種した。

mite female imago 5 solid inoculation was done.

1日間産卵させた後、実態顕微鏡下で10卵以上の産卵を確認し、500a.i.ppmに調製した水和剤をエアブラシで3mg/cm<sup>2</sup>定量散布した。

egg-producing of 10 eggs or more was verified with 1 day egg-producing later and underactual condition microscope, wettable which is manufactured in 500 a.i.ppm 3 mg /cm<sup>2</sup>;SP&gt;2&lt;/SP&gt; quantification scattering fabric was done with air brush.

25 deg Cの恒温室で保持し、処理2日後に成虫の生死を調査し、成虫を除去した。

You kept with constant temperature chamber of 25 deg C, investigated living and dead of the adult after treatment 2 day,

の生死を調査し、成虫を除去した。

removed adult .

処理 9 日後に未孵化卵および生存幼若虫を調査した。

unhatched egg and survival nymph was investigated young after treatment 9 day.

【0117】

[0117]

100%の殺卵効果を示した化合物は、17-6、17-7、17-10、17-11、17-16、17-17、19-6、19-7であった。

compound which shows 100% ovicidal effect was, 17 - 6 and 17 - 7 and 17 - 10 and 17 - 11 and 17 - 16 and 17 - 17 and 19 - 6 and 19 - 7.

生物試験例8			
organism Test Example 8			
ワタアブラムシ	(Aphis	gossypii	)
Aphis gossypii Glover (cotton aphid)	Aphis	gossypii	)

ブラムシ 0~1 齢幼虫を 10~20 頭接種した。

[buramushi] 0 - 1 instar larva was done 10 - 20 head inoculation .

数時間後定着した個体数をカウントした後に 500a.i.ppm に調製した水和剤をエアブラシを用いて 2ml 散布した。

After counting number of bodies which after several hours becomes fixed wettable which is manufactured in 500 a.i.ppm 2 ml scattering fabric was done making use of air brush .

25 deg C の恒温室で保持し、処理 3 日後に生死を確認した。

You kept with constant temperature chamber of 25 deg C, verified living and dead after the treatment 3 days .

100%の殺幼虫活性を示した化合物は 13-2、15-5、16-1、16-2、16-3、16-4、17-5、17-6、17-8、17-9、17-10、17-16、17-17、19-3、19-7、20-4 であった。

compound which shows 100% larvicidal activity was 13 - 2 and 15 - 5 and 16 - 1 and 16 - 2 and 16 - 3 and 16 - 4 and 17 - 5 and 17 - 6 and 17 - 8 and 17 - 9 and 17 - 10 and 17 - 16 and 17 - 17 and 19 - 3 and 19 - 7, 20 - 4.

生物試験例9			
organism Test Example 9			
コナガ(Plutella	xylostella	)	
Plutella xylostella (Linnaeus) (diamondback moth, cabbage moth)	xylostella	)	

寒天ゲルに浮かべ(2 葉/シャーレ)、産卵数を数えた後、500a.i.ppm に調製した水和剤をガラススプレーで 3mg/cm<sup>2</sup> 定量散布した。

You floated in agar gel and (2 leaf /petri dish), after counting number of hatched eggs, 3 mg /cm<sup>2</sup> quantification scattering fabric you did wettable which is manufactured in 500 a.i.ppm with glass spray .

処理 5 日後、未孵化卵数と生存幼虫を調べた。

After treatment 5 day, number of unhatched eggs and survival larva were inspected.

100%の殺卵活性を示した化合物は、17-3、17-4、17-5、17-6、17-9、17-10、17-16、17-17、17-18、17-19、19-7、20-4 であった。

compound which shows 100% ovicidal activity was, 17 - 3 and 17 - 4 and 17 - 5 and 17 - 6 and 17 - 9 and 17 - 10 and 17 - 16 and 17 - 17 and 17 - 18 and 17 - 19 and 19 - 7, 20 - 4.

生物試験例10			

organism Test Example 10			
トビイロウンカ	(Nilaparvata	lugens	)
Nilaparvata lugens (Stal ) (brown rice planthopper )	Nilaparvata	lugens	)

後にトビイロウンカ幼虫を接種した。

Nilaparvata lugens (Stal ) (brown rice planthopper ) larva inoculation was done afterwards.

成虫羽化後(7日後)に調査を行ない生存個体数をカウントした。

You investigated in (7 days later) after adult wing formation and counted survival number of bodies .

100%の殺幼虫活性を示した化合物は、2-2、17-9、17-16、17-17、19-7であった。

compound which shows 100% larvicidal activity was, 2 - 2 and 1 7 - 9 and 1 7 - 16and 17 - 17, 19 - 7.

【0118】

[0118]

次に本発明の化合物を用いた製剤例を示す。

Formulation Example which uses compound of this invention next is shown.

【0119】

[0119]

【製剤例 1】

【Formulation Example 1】

本発明化合物(I)10 部、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物 1 部、ポリオキシエチレンアルキルフェノールエーテル 0.5 部、ホワイトカーボン 0.5 部、およびケイソウ土 88 部をよく粉碎混合して水和剤を得た。

the compound of this invention (I ) powder fragment mixing 10 part , naphthalene sulfonic acid formalin condensate 1 part , polyoxyethylene alkylphenol ether 0.5 part , white carbon 0.5 part , and diatomaceous earth 88 section well, itacquired wettable .

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**